

WO9408943

Publication Title:

2-AMINO-1,3-PROPANEDIOL COMPOUND AND IMMUNOSUPPRESSANT

Abstract:

Abstract of WO9408943

A 2-amino-1,3-propanediol compound represented by general formula (I) or a pharmaceutically acceptable salt thereof, and an immunosuppressant containing the same as the active ingredient. In said formula R represents optionally substituted linear or branched carbon chain, optionally substituted aryl or optionally substituted cycloalkyl; and R<2>, R<3>, R<4> and R<5>, which may be the same or different from one another, represent each hydrogen, alkyl, aralkyl, acyl or alkoxycarbonyl. The compound is immunodepressant and useful as an inhibitor against rejection in organ or bone marrow transplantation, as a preventive or remedy for autoimmune diseases and so forth, or a reagent in the medical and pharmaceutical fields. Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

Courtesy of <http://v3.espacenet.com>

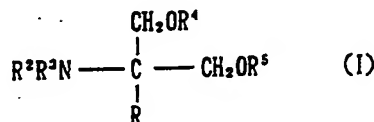


特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類 5 C07C 215/10, 233/18, 215/24 C07C 215/28, 323/25, 225/06 C07C 229/22, 219/04, 217/28 A61K 31/13, 31/195, 31/215 A61K 31/24		A1	(11) 国際公開番号 WO 94/08943
(21) 国際出願番号 PCT/JP93/01515 (22) 国際出願日 1993年10月18日(18. 10. 93)		(43) 国際公開日 1994年4月28日(28.04.1994)	
(30) 優先権データ 特願平4/283281 1992年10月21日(21. 10. 92) JP 特願平5/179427 1993年7月20日(20. 07. 93) JP		(74) 代理人 千葉健治(OHIBA, Kenji)[JP/JP] 〒358 埼玉県入間市小谷田3丁目7番25号 吉富製薬株式会社 東京研究所内 Saitama, (JP) 弁理士 高島 一(TAKASHIMA, Hajime) 〒541 大阪府大阪市中央区平野町三丁目3番9号 湯木ビル Osaka, (JP)	
(71) 出願人(米国を除くすべての指定国について) 吉富製薬株式会社 (YOSHITOMI PHARMACEUTICAL INDUSTRIES, LTD.) (JP/JP) 〒541 大阪府大阪市中央区平野町二丁目6番9号 Osaka, (JP) 台糖株式会社(TAITO CO., LTD.)(JP/JP) 〒103 東京都中央区日本橋大伝馬町7番5号 Tokyo, (JP)		(81) 指定国 CA, JP, KR, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).	
(72) 発明者; および (75) 発明者/出願人(米国についてのみ) 藤多哲朗(FUJITA, Tetsuro)[JP/JP] 〒617 京都府向日市鶏冠井町大極殿40番地23 Kyoto, (JP) 佐々木重夫(SASAKI, Shigeo)[JP/JP] 〒654 兵庫県神戸市須磨区須磨寺町4丁目5番8号201 Hyogo, (JP) 米田雅彦(YONETA, Masahiko)[JP/JP] 〒654 兵庫県神戸市須磨区須磨寺町4丁目5番8号303 Hyogo, (JP) 三品 正(MISHINA, Tadashi)[JP/JP] 安達邦知(ADACHI, Kunitomo)[JP/JP]		添付公開書類 国際調査報告書	

(54) Title : 2-AMINO-1,3-PROPANEDIOL COMPOUND AND IMMUNOSUPPRESSANT

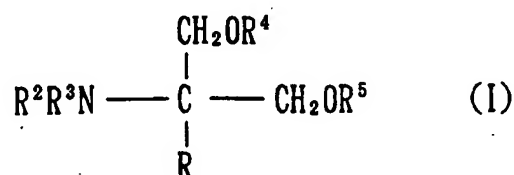
(54) 発明の名称 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物および免疫抑制剤



(57) Abstract

A 2-amino-1,3-propanediol compound represented by general formula (I) or a pharmaceutically acceptable salt thereof, and an immunosuppressant containing the same as the active ingredient. In said formula R represents optionally substituted linear or branched carbon chain, optionally substituted aryl or optionally substituted cycloalkyl; and R², R³, R⁴ and R⁵, which may be the same or different from one another, represent each hydrogen, alkyl, aralkyl, acyl or alkoxycarbonyl. The compound is immunodepressant and useful as an inhibitor against rejection in organ or bone marrow transplantation, as a preventive or remedy for autoimmune diseases and so forth, or a reagent in the medical and pharmaceutical fields.

一般式 (I)



(式中、Rは置換基を有していてもよい直鎖あるいは分枝鎖状の炭素鎖、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいシクロアルキル等を、R²、R³、R⁴、R⁵は同一または異なって水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。)

により表される2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩、およびこれらを活性成分として含有する免疫抑制剤。

本発明の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物類は免疫抑制作用を示し、臓器や骨髄移植の際の拒絶反応の抑制、自己免疫疾患等における予防または治療剤として、あるいは医学、薬学における試薬として有用である。

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第1頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AT	オーストリア	CS	チェッコスロヴァキア	KR	大韓民国	PL	ポーランド
AU	オーストラリア	CZ	チェッコ共和国	KZ	カザフスタン	PT	ポルトガル
BB	バルバドス	DE	ドイツ	LI	リヒテンシュタイン	RO	ルーマニア
BE	ベルギー	DK	デンマーク	LK	スリランカ	RU	ロシア連邦
BF	ブルキナ・ファソ	ES	スペイン	LU	ルクセンブルグ	SD	スーダン
BG	ブルガリア	FI	フィンランド	LV	ラトヴィア	SE	スウェーデン
BJ	ベナン	FR	フランス	MC	モナコ	SI	スロヴェニア
BR	ブラジル	GA	ガボン	MG	マダガスカル	SK	スロヴァキア共和国
BY	ベラルーシ	GB	イギリス	ML	マリ	SN	セネガル
CA	カナダ	GN	ギニア	MN	モンゴル	TD	チャード
CF	中央アフリカ共和国	GR	ギリシャ	MR	モーリタニア	TG	トーゴ
CG	コンゴ	HU	ハンガリー	MW	マラウイ	UA	ウクライナ
CH	スイス	IE	アイルランド	NE	ニジェール	US	米国
CI	コート・ジボアール	IT	イタリア	NL	オランダ	UZ	ウズベキスタン共和国
CM	カメルーン	JP	日本	NO	ノルウェー	VN	ヴェトナム
CN	中国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NZ	ニュージーランド		

明 細 書

2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物および免疫抑制剤

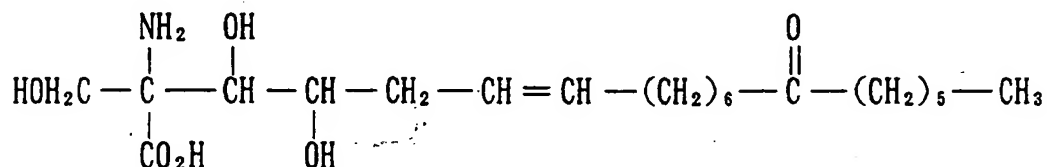
「技術分野」

本発明は、医薬、特に免疫抑制剤として有用な2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物類に関する。

「背景技術」

近年、臓器移植の際に生ずる拒否反応を抑制するためにシクロスポリンが使用されている。開発中の化合物も含めて、いわゆる免疫抑制剤は、さらに関節リウマチ等の治療薬としても期待されてきている。しかしながら、前記シクロスポリンは腎障害等の副作用を生起するという問題点を有している。

一方、特開平1-104087号公報には、冬虫夏草菌 (*Isaria sinclairii*) の液体培養物から免疫抑制物質が採取されることが記載され、当該物質は米国特許第3928572号明細書に開示された式



により表される(2S, 3R, 4R) - (E) - 2-アミノ-3, 4-ジヒドロキシ-2-ヒドロキシメチル-14-オキソイコサ-6-エン酸であることが確認されている。さらに、特開平3-128347号公報には同系統の化合物が免疫抑制作用を有することが記載されている。

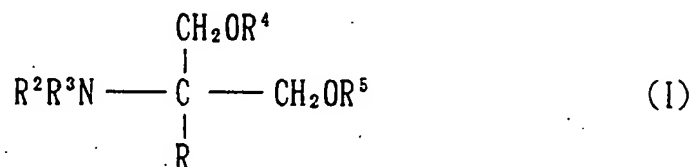
一方、メルク・インデックス (Merck Index) 第11版により、2-アミノ-2-メチル-1, 3-プロパンジオール (記事番号: 460)、2-アミノ-2-エチル-1, 3-プロパンジオール (記事番号: 451) および2-アミノ-2-ヒドロキシメチル-1, 3-プロパンジオール (トロメタミンともいう、記事番号: 9684) が、界面活性剤や医薬品等の合成中間体、乳化剤、またガス吸着剤等として用いられること、およびトロメタミンはアルカリ化剤としての医薬用途を有していることが知られている。特開昭62-416号公報によると、2

ーアミノー２－（炭素数１～５のアルキル）－１，３－プロパンジオールを含有する染毛剤が開示されている。また、米国特許第４９１０２１８号明細書およびジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー（J. Med. Chem.）第３３巻２３８５～２３９３頁（１９９０年）には、抗腫瘍剤の合成中間体として、２ーアミノー２－（メチルまたはエチル）－１，３－プロパンジオールが記載されている。特開昭５９－１９２９６２号公報には、抗原または抗体感作ラテックス試薬の安定剤として、前記２ーアミノー２－（炭素数１～５のアルキル）－１，３－プロパンジオールまたは２ーアミノー１，３－プロパンジオールが使用できる旨の開示がなされている。さらに、米国特許第３０６２８３９号明細書には、トランクライザー作用を有する２ーメチルまたはエチルアミノー２－（フリルメチル、フェニルメチルまたは低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくは無置換アミンにより置換されたフェニルメチル）－１，３－プロパンジオールが、ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー（J. Org. Chem.）第２５巻２０５７～２０５９頁（１９６０年）には、２ーメチルアミノー２－（フェニルメチルまたは２ーメチル、３ーメチル、４ーメチル、４ーメトキシもしくは４ーヒドロキシにより置換されたフェニルメチル）－１，３－プロパンジオールが記載されている。しかしながら、これら化合物が臓器等の移植時に発生する拒絶反応の抑制作用や、自己免疫疾患の予防もしくは治療効果等、免疫抑制作用を有することは知られていない。

本発明の目的は、すぐれた免疫抑制作用を示し、かつ副作用の少ない新規な２ーアミノー１，３－プロパンジオール化合物類を提供することである。

「発明の開示」

本発明は、（１）一般式



〔式中、Rは置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖（当該鎖中

に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-N(R^6)-$ (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体が置換していてもよい} または置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、 R^4 、 R^5 がアルキル、アリアルまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

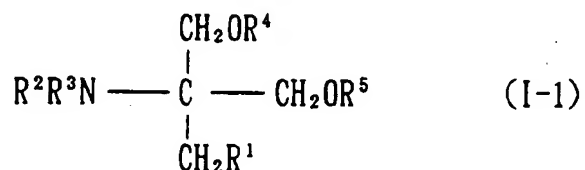
ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハ

ロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。さらに、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、Rが炭素数1～5個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていないなければならない。また、Rがフリルメチル、フェニルメチルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルメチルのとき、R²、R³の一方はメチルまたはエチルではない。)により表される2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(2) 一般式



〔式中、R¹は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖〔当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R⁶)- (ここで、R⁶は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端(ω位)に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していて

もよいヘテロアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい} または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、 R^4 、 R^5 がアルキル、アリールまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

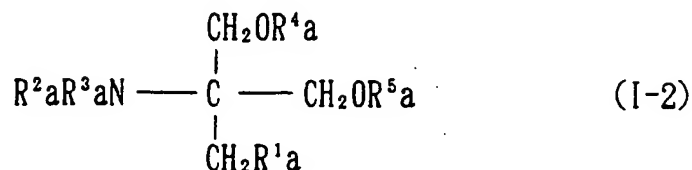
ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、 R^1 が炭素数1～4個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1 がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニ

ルのとき、 R^2 、 R^3 の一方はメチルまたはエチルではない。) により表される上記 (1) の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(3) 一般式



〔式中、 $R^1\text{a}$ は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖〔当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-\text{N}(\text{R}^6)-$ (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンから選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい〕、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいシクロアルキルを示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。〕

ここで、置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルは、置換基として、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖〔当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-\text{N}(\text{R}^6)-$ (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンから選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい〕、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいフェノキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルから

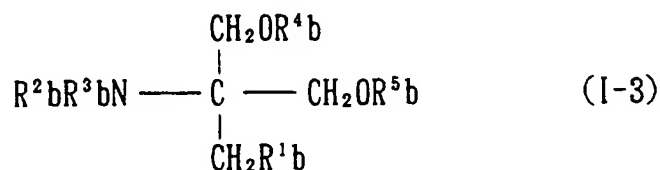
選ばれる基を有していてもよい。

また、置換基を有していてもよい炭素鎖は、置換基として、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいフェノキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルから選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいフェノキシおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルは、その置換基として、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、 R^{1a} が炭素数1～4個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^{1a} がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルのとき、 R^{2a} 、 R^{3a} の一方はメチルまたはエチルではない。〕により表される上記(1)または(2)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(4) 一般式



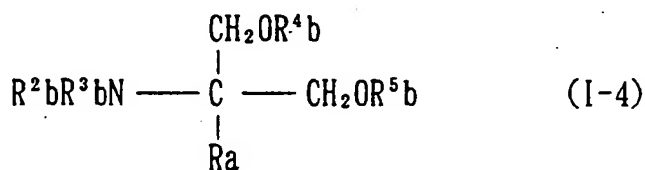
〔式中、 R^{1b} は置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよい

アルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいフェニルまたは置換基を有していてもよいシクロアルキルを示し、 R^2b 、 R^3b 、 R^4b 、 R^5b は同一または異なってそれぞれ水素、アルキルまたはアシルを示す。

ここで、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニルは、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルから選ばれる基を有していてもよい。また、前記置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルは、置換基として、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシおよびカルボキシから選ばれる1～3個を有することができる。

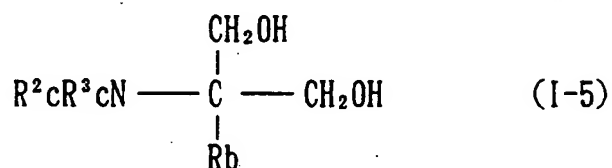
ただし、 R^1b が炭素数1～4個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1b がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルのとき、 R^2b 、 R^3b の一方はメチルまたはエチルではない。)により表される上記(3)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(5) 一般式



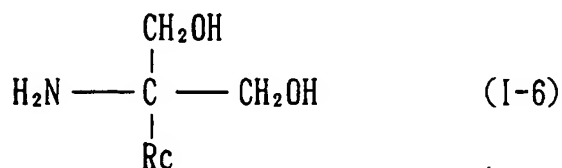
〔式中、R^a は鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R⁶)- (ここで、R⁶ は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す) およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい炭素数 12 から 22 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示し、R^{2b}、R^{3b}、R^{4b}、R^{5b} は同一または異なってそれぞれ水素、アルキルまたはアシルを示す。〕により表される上記 (1)、(2)、(3) または (4) の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(6) 一般式



〔式中、R^b は鎖中に酸素原子を有していてもよく、また置換基として、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい炭素数 13 から 20 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示し、R^{2c}、R^{3c} は同一または異なってそれぞれ水素、アルキルを示す。〕により表される上記 (5) の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(7) 一般式

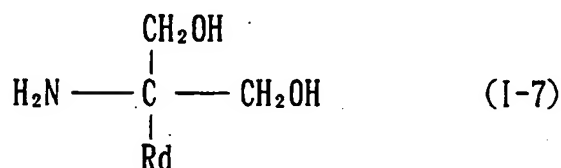


〔式中、R^c は炭素数 13 から 20 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルまたは置

換基としてハロゲンを有する炭素数 13 から 20 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示す。) により表される上記 (5) または (6) の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(8) 2-アミノ-2-トリデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-テトラデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-ペンタデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-ヘキサデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-ヘプタデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-ノナデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-イコシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(12-フルオロドデシル)-1, 3-プロパンジオールおよび 2-アミノ-2-(14-フルオロテトラデシル)-1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記 (5)、(6) または (7) の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(9) 一般式



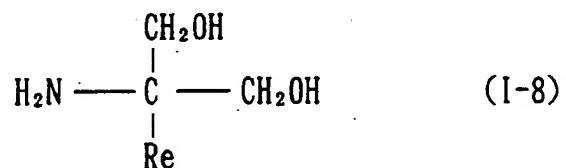
〔式中、Rd はフェニルアルキル、置換フェニルアルキル、シクロアルキルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロサイクリックアルキルまたは置換ヘテロサイクリックアルキルを示す。〕

ここで、アルキル部は炭素鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-\text{N}(\text{R}^6)-$ (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す) およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルア

ミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。

また、置換フェニルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、置換ヘテロアリールアルキルまたは置換ヘテロサイクリックアルキルは、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、ハロアラルキルオキシ、アラルキルオキシアルキル、フェノキシアルキル、フェノキシアルコキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。) により表される上記 (1)、(2)、(3) または (4) の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(10) 一般式

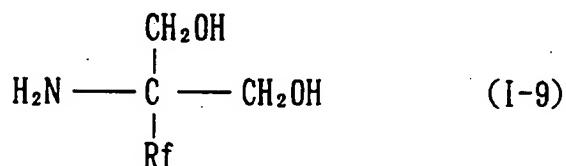


〔式中、Re はアルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいフェニルアルキル；炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアルキル、フェノキシアルコキシもしくはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキル；アルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいシクロアルキルアルキル；炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたシクロアルキルアルキル；アルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいヘテロアリールアルキル；炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置

換されたヘテロアリールアルキル；アルキル部の炭素数が6～20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数6～20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアルキルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-N(R^6)-$ （ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す）およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。）により表される上記(9)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(11) 一般式

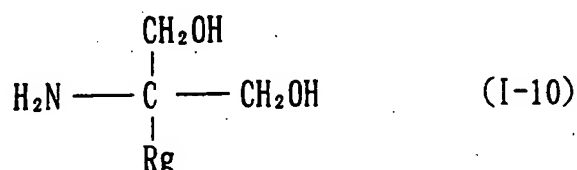


〔式中、 Rf はアルキル部の炭素数が6～20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が1または2個介在していてもよいフェニルアルキル；炭素数6～20個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数6～20個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数6～20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアルキル、フェノキシアルコキシもしくはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキル；アルキル部の炭素数が6～20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が1または2個介在していてもよいシクロアルキルアルキル；炭素数6～20個の直鎖もしくは分枝鎖状の

アルキルにより置換されたシクロアルキルアルキル；アルキル部の炭素数が6～20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が1または2個介在していてもよいヘテロアリールアルキル；炭素数6～20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロアリールアルキル；アルキル部の炭素数が6～20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が1または2個介在していてもよいヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数6～20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアルキルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖に置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。〕により表される上記(9)または(10)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

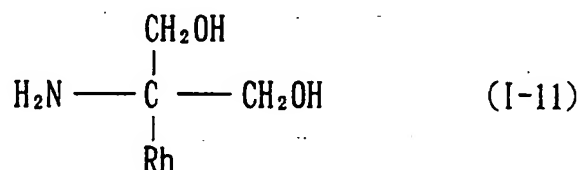
(12) 一般式



〔式中、Rgはアルキル部の炭素数が6～20個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が1または2個介在していてもよいフェニルアルキル；炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアルキル、フェノキシアルコキシまたはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキル；アルキル部の炭素数が6～20個であるシクロアルキルアルキル；炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換さ

れたシクロアルキルアルキル；アルキル部の炭素数が6～20個であるヘテロアリールアルキル；炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロアリールアルキル；アルキル部の炭素数が6～20個であるヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアルキルを示す。）により表される上記（9）、（10）または（11）の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

（13）一般式



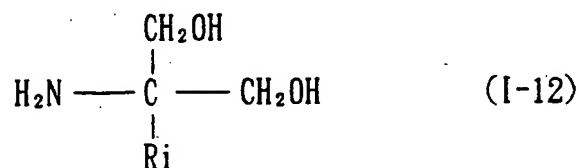
〔式中、Rh はアルキル部の炭素数が6～20個であるフェニルアルキル、アルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が6～20個であるフェニルアルコキシアルキル、アルキル部の炭素数が6～20個であるフェノキシアルキルまたはアルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が6～20個であるフェノキシアルコキシアルキルを示す。〕により表される上記（12）の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

（14）2-アミノ-2-（8-フェニルオクチル）-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-（9-フェニルノニル）-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-（10-フェニルデシル）-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-（11-フェニルウンデシル）-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-（12-フェニルドデシル）-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-（13-フェニルトリデシル）-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-（14-フェニルテトラデシル）-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-（15-フェニルペンタデシル）-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-（16-フェニルヘキサデシル）-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔6-（8-フェニルオクチルオキシ）ヘキシル〕-1,3-プ

ロパンジオール、2-アミノ-2-(8-フェニルメチルオキシオクチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(9-フェノキシノニル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(12-フェノキシドデシル)-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-[6-(2-フェノキシエチルオキシ)ヘキシル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(13)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

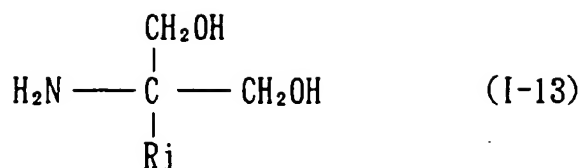
(15) 2-アミノ-2-(10-フェニルデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(13-フェニルトリデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[6-(8-フェニルオクチルオキシ)ヘキシル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(8-フェニルメチルオキシオクチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(9-フェノキシノニル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(12-フェノキシドデシル)-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-[6-(2-フェノキシエチルオキシ)ヘキシル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(13)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(16) 一般式



〔式中、Ri はハロゲンで置換されていてもよい炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換されたフェニルアルキルを示す。ここで、フェニルアルキルのアルキル部はヒドロキシで置換されていてもよい。〕により表される上記(12)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(17) 一般式



〔式中、R_j はハロゲンで置換されていてもよい炭素数 6～14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数 6～14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数 6～14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換され、かつアルキル部が炭素数 2～6 のアルキルであって、当該アルキル部がヒドロキシで置換されていてもよいフェニルアルキルを示す。〕により表される上記 (16) の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(18) 2-アミノ-2-〔2-(4-ヘプチルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-オクチルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ノニルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-デシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ウンデシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ドデシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-トリデシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-テトラデシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ヘキシルオキシフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ヘプチルオキシフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-オクチルオキシフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ノニルオキシフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-デシルオキシフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ドデ

シルオキシフェニル) エチル] - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-
 [2-(4-トリデシルオキシフェニル) エチル] - 1, 3-プロパンジオール、
 2-アミノ-2-[2-(4-(8-フルオロオクチル) フェニル) エチル] -
 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(12-フルオロド
 デシル) フェニル) エチル] - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[
 2-(4-(7-フルオロヘプチルオキシ) フェニル) エチル] - 1, 3-プロ
 パンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(11-フルオロウンデシルオキ
 シ) フェニル) エチル] - 1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-[
 2-(4-(7-オクテニルオキシ) フェニル) エチル] - 1, 3-プロパンジ
 オールから選ばれる上記(16)または(17)の2-アミノ-1, 3-プロパ
 ンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

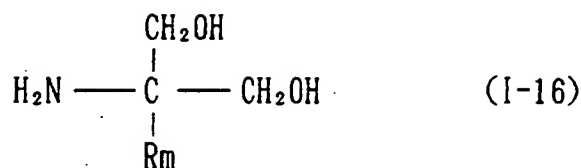
(19) 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルフェニル) エチル] - 1, 3-
 プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-オクチルフェニル) エチル]
 - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ノニルフェニル)
 エチル] - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-デシルフ
 ェニル) エチル] - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-
 ウンデシルフェニル) エチル] - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-
 [2-(4-ドデシルフェニル) エチル] - 1, 3-プロパンジオール、2-ア
 ミノ-2-[2-(4-ヘプチルオキシフェニル) エチル] - 1, 3-プロパン
 ジオール、2-アミノ-2-[2-(4-オクチルオキシフェニル) エチル] -
 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ノニルオキシフェニ
 ル) エチル] - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ウン
 デシルオキシフェニル) エチル] - 1, 3-プロパンジオールおよび2-アミ
 ノ-2-[2-(4-(7-オクテニルオキシ) フェニル) エチル] - 1, 3-プ
 ロパンジオールから選ばれる上記(16)または(17)の2-アミノ-1, 3
 -プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(20) 一般式

エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(7-フェニルヘプチルオキシ)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(8-フェニルオクチルオキシ)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔4-(6-(4-フルオロフェニル)ヘキシルオキシ)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(5-フェニルペンチルオキシメチル)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(4-フェノキシブチルオキシ)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(5-フェノキシペンチルオキシ)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(6-フェノキシヘキシルオキシ)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(7-フェノキシヘプチルオキシ)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(4-フェノキシブチル)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(5-フェノキシペンチル)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(6-フェノキシヘキシル)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔2-(4-(7-フェノキシヘプチル)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(20)または(21)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(23) 2-アミノ-2-〔2-(4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔2-(4-(5-フェニルペンチルオキシメチル)フェニル)エチル} - 1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(20)または(21)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

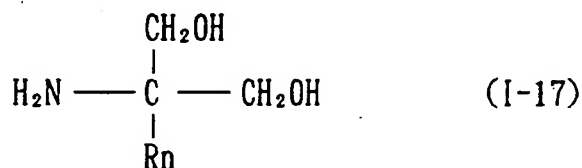
(24) 一般式



〔式中、R_m はアルキル部の炭素数の総計が6～20個であるアルキル置換シクロアルキルアルキルを示す。〕により表される上記(12)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(25) 2-アミノ-2-〔3-(4-ヘプチルシクロヘキシル)プロピル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔4-(4-ブチルシクロヘキシル)ブチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-オクチルシクロヘキシル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ノニルシクロヘキシル)エチル]-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔2-(4-ドデシルシクロヘキシル)エチル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(24)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

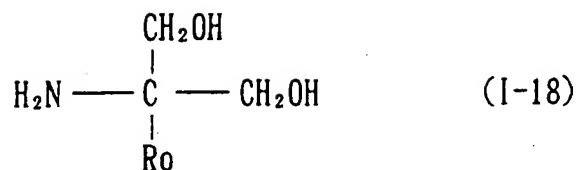
(26) 一般式



〔式中、R_n はアルキル部の炭素数の総計が6～20個である1-アルキル置換ピペリジン-4-イルアルキルを示す。〕により表される上記(12)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(27) 2-アミノ-2-〔2-(1-オクチルピペリジン-4-イル)エチル]-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔2-(1-ドデシルピペリジン-4-イル)エチル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(26)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

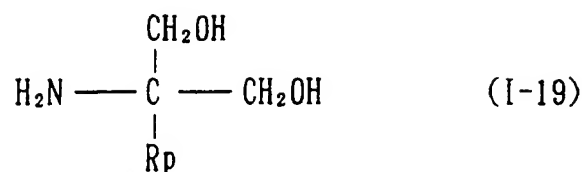
(28) 一般式



〔式中、Ro はアルキル部の炭素数が6～20個であるチエニルアルキル、アルキル部の炭素数の総計が6～20個であるアルキル置換チエニルアルキル、アルキル部の炭素数が6～20個であるピリジルアルキルまたはアルキル部の炭素数の総計が6～20個であるアルキル置換ピリジルアルキルを示す。〕により表される上記(12)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

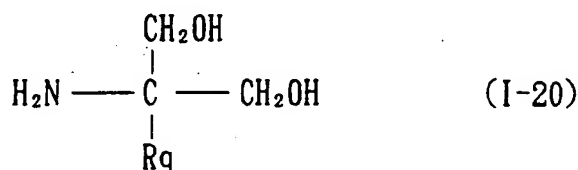
(29) 2-アミノ-2-〔2-(5-オクチル-2-チエニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(5-ノニル-2-チエニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(5-デシル-2-チエニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(5-ドデシル-2-チエニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔13-(2-チエニル)トリデシル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(5-オクチル-2-ピリジル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(5-デシル-2-ピリジル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔13-(2-ピリジル)トリデシル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(2-オクチル-5-ピリジル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(2-デシル-5-ピリジル)エチル〕-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔13-(3-ピリジル)トリデシル〕-1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(28)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(30) 一般式



〔式中、Rp は炭素数が6～18個であるアルキルにより置換されたフェニル、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクルを示す。〕により表される上記(1)または(2)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

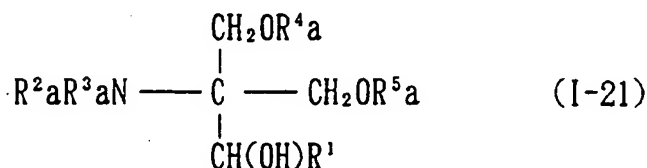
(31) 一般式



〔式中、Rq は炭素数が6～18個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される上記(30)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(32) 2-アミノ-2-(4-デシルフェニル)-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(4-ドデシルフェニル)-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(4-テトラデシルフェニル)-1,3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-(4-ヘキサデシルフェニル)-1,3-プロパンジオールから選ばれる上記(30)または(31)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(33) 一般式



〔式中、R¹ は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖（当該鎖

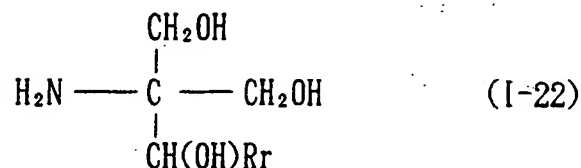
中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-N(R^6)$ (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端 (ω 位) に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい} または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体を示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコ

キシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。)により表される上記(1)または(2)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

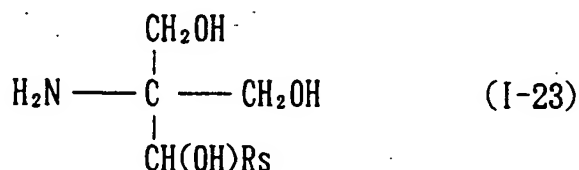
(34) 一般式



(式中、Rr は鎖中に二重結合またはカルボニルを有していてもよく、また水酸基および/またはヒドロキシイミノにより置換されていてもよいアルキルを示す。)により表される上記(33)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(35) 2-アミノ-2-(1, 2, 12-トリヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(1, 12-ジヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(1, 2, 4-トリヒドロキシブチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(1, 2, 12-トリヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-(1, 12-ジヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(33)または(34)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(36) 一般式

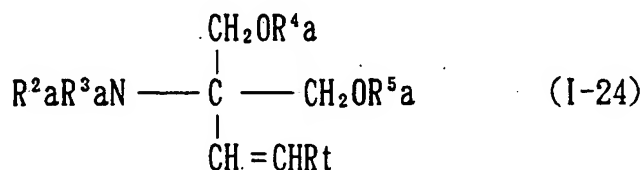


(式中、Rs はハロゲンで置換されていてもよい炭素数6~14個の直鎖もしくは

は分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換されたフェニルアルキルを示す。)により表される上記(33)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(37) 2-アミノ-2-〔1-ヒドロキシ-2-(4-オクチルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ドデシルフェニル)-1-ヒドロキシエチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ヘプチルオキシフェニル)-1-ヒドロキシエチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔1-ヒドロキシ-2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(8-フルオロオクチル)フェニル)-1-ヒドロキシエチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(12-フルオロドデシル)フェニル)-1-ヒドロキシエチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(7-フルオロヘプチルオキシ)フェニル)-1-ヒドロキシエチル〕-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔1-ヒドロキシ-2-(4-(11-フルオロウンデシルオキシ)フェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(36)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(38) 一般式



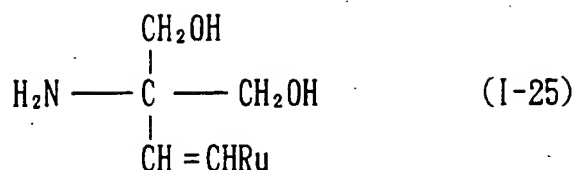
〔式中、Rtは置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖(当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R⁶)- (ここで、R⁶は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を

有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい} または置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体を示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。) により表される上記(1)または(2)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

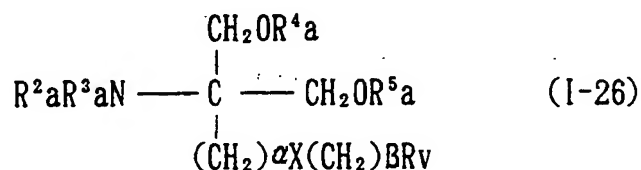
(39) 一般式



〔式中、Ru は炭素数が4～16個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される上記(38)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(40) 2-アミノ-2-〔2-(4-オクチルフェニル)エテニル〕-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-デシルフェニル)エテニル〕-1,3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ドデシルフェニル)エテニル〕-1,3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔2-(4-テトラデシルフェニル)エテニル〕-1,3-プロパンジオールから選ばれる上記(38)または(39)の2-アミノ-1,3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(41) 一般式

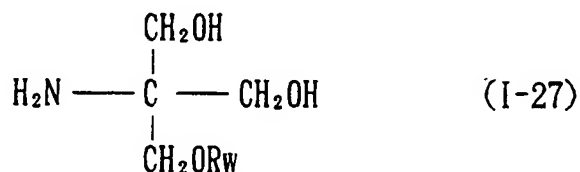


〔式中、Rv は置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体を示し、R²a、R³a、R⁴a、R⁵aは同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示し、Xは酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R⁶)- (ここで、R⁶は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)を示し、α、βは0または1～20の整数(但し、α+βは5～20である)を示す。〕

また、上記置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環

体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。〕により表される上記(1)または(2)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(42) 一般式

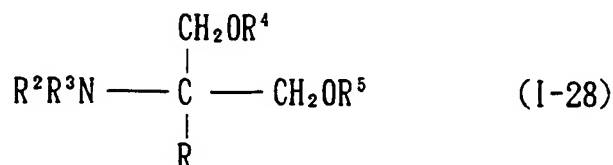


〔式中、R_w は炭素数が4～16個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される上記(41)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(43) 2-アミノ-2-(4-オクチルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(4-デシルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(4-ドデシルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-(4-テトラデシルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオールから選ばれる上記(41)または(42)の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

(44) 上記(1)～(4)のいずれかの化合物を含有してなる医薬組成物。

(45) 一般式



〔式中、Rは置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖〔当該鎖中

に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-N(R^6)-$ (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体が置換していてもよい) または置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、 R^4 、 R^5 がアルキル、アリアルまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハ

ロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。さらに、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。)により表される 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩を含有してなる免疫抑制剤。

(46) 上記(1)～(43)のいずれかに記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩を含有してなる免疫抑制剤。

(47) 免疫抑制剤が拒絶反応抑制剤である上記(45)または(46)の薬剤。

(48) 免疫抑制剤が自己免疫疾患の予防または治療薬である上記(45)または(46)の薬剤。

(49) 自己免疫疾患の予防または治療薬がリウマチの予防または治療薬である上記(48)の薬剤に関する。

本明細書における各記号で表される基について以下に説明する。

R、R¹、R^{1a}、R^tにおける炭素鎖とは、炭素数 1～30 個の直鎖または分枝鎖状の炭素鎖であり、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、第 3 級ブチル、ペンチル、イソペンチル、第 3 級ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル、ノナデシル、イコシル、ヘンイコシル、ドコシル、トリコシル、テトラコシル、ペンタコシル、ヘキサコシル、ヘプタコシル、オクタコシル、ノナコシル、トリアコンチル等があげられる。

R、R¹、R^tにおけるアリーレンとは、フェニレン、ナフチレン等があげら

れる。好ましくはフェニレンである。

R、R¹、R^{1a}、R^tにおけるシクロアルキレンとは、炭素数3～10個のシクロアルキレンであって、例えば、シクロプロピレン、シクロブチレン、シクロペンチレン、シクロヘキシレン、シクロヘプチレン、シクロオクチレン、シクロノニレン、シクロデシレン等があげられる。好ましくは、シクロヘキシレンである。

R、R¹、R^tにおけるヘテロアリーレンは1～2個のヘテロ原子（窒素原子、酸素原子、硫黄原子から選ばれる）を環中に含んでもよい5～6員のヘテロアリーレンであって、たとえば、チオフェン-（2，4-、2，5-または3，4-）イレン、フラン-（2，4-、2，5-または3，4-）イレン、ピロール-（1，3-、2，4-、2，5-または3，4-）イレン、イミダゾール-（1，4-、2，5-または2，6-）イレン、チアゾール-（2，4-または2，5-）イレン、イソチアゾール-（3，4-または3，5-）イレン、オキサゾール-（2，4-または2，5-）イレン、イソオキサゾール-（3，4-または3，5-）イレン、ピリジン-（2，4-、2，5-、2，6-または3，5-）イレン、ピリミジン（2，4-または2，5-）イレン、ピラジン-2，5-イレン、ピリダジン-（3，5-または3，6-）イレン、ピラン-（2，4-、2，5-または2，6-）イレン等があげられる。好ましくはチオフェン-2，5-イレン、ピリジン-2，5-イレンである。

R、R¹、R^tにおける上記ヘテロアリーレンの脂環体は、上記ヘテロアリーレンが飽和されているものであって、たとえば、ピロリジン-（1，3-、2，4-、2，5-または3，4-）イレン、ピペリジン-（1，4-、2，4-、2，5-、2，6-または3，5-）イレン、ピペラジン-1，4-イレン、モルホリン-2，4-または3，4-イレン、チオモルホリン-2，4-または3，4-イレン等があげられる。

R、R¹、R^t、R^vにおけるアリールとは、フェニル、ナフチル等があげられる。好ましくはフェニルである。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、R^p、R^t、R^vにおけるシクロアルキルとは、炭素

数3～10個のシクロアルキルであって、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル等があげられる。好ましくはシクロヘキシルである。

R、R¹、R_p、R_t、R_vにおけるヘテロアリアルは1～4個のヘテロ原子（窒素原子、酸素原子、硫黄原子から選ばれる）を環中に含んでいてもよい5～6員のヘテロアリアルであって、たとえば、チエニル（2-チエニル、3-チエニル）、フリル（2-フリル、3-フリル）、ピロリル（1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル）、イミダゾリル（2-イミダゾリル、4-イミダゾリル等）、ピラゾリル（3-ピラゾリル、4-ピラゾリル等）、トリアゾリル、テトラゾリル、チアゾリル（2-チアゾリル、4-チアゾリル等）、イソチアゾリル（3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル等）、オキサゾリル（2-オキサゾリル、4-オキサゾリル等）、イソオキサゾリル（3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル等）、ピリジル（2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル）、ピラジニル、ピリミジニル（2-ピリミジニル、4-ピリミジニル等）、ピリダジニル（3-ピリダジニル、4-ピリダジニル等）、ピラニル（2-ピラニル、3-ピラニル、4-ピラニル）等の単環式ヘテロアリアル、インドリル（2-インドリル、3-インドリル）、キノリル（2-キノリル、3-キノリル）、イソキノリル（1-イソキノリル、3-イソキノリル）、ベンゾフラニル（2-ベンゾフラニル、3-ベンゾフラニル）、ベンゾチエニル（2-ベンゾチエニル、3-ベンゾチエニル）、1H-ベンズイミダゾール-2-イル、クロメニル（2-クロメニル、3-クロメニル、4-クロメニル）等の二環式ヘテロアリアル等があげられる。

R、R¹、R_t、R_vにおける上記ヘテロアリアルの脂環体は、上記単環式ヘテロアリアルが飽和されているものであって、たとえば、ピロリジニル（1-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル）、ピペリジル（2-ピペリジル、3-ピペリジル、4-ピペリジル）、ピペリジノ、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル等があげられる。

R_pにおけるヘテロサイクルとは、ヘテロアリアルの脂環体を示す。

R^{1b}、R^rにおけるアルキルとは、炭素数1～30個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、第3級ブチル、ペンチル、イソペンチル、第3級ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル、ノナデシル、イコシル、ヘンイコシル、ドコシル、トリコシル、テトラコシル、ペンタコシル、ヘキサコシル、ヘプタコシル、オクタコシル、ノナコシル、トリアコンチル等があげられる。

R^aにおける炭素数12～22個の直鎖または分枝鎖状のアルキル、R^b、R^cにおける炭素数13～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルとは、上記アルキルの所定の炭素数のものを示す。

R^{1b}におけるアルケニルとは、炭素数2～30個の直鎖または分枝鎖状のアルケニルであって、例えば、エテニル、プロペニル、イソプロペニル、ブテニル、イソブテニル、ペンテニル、イソペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル、デセニル、ウンデセニル、ドデセニル、トリデセニル、テトラデセニル、ペンタデセニル、ヘキサデセニル、ヘプタデセニル、オクタデセニル、ノナデセニル、イコセニル、ヘンイコセニル、ドコセニル、トリコセニル、テトラコセニル、ペンタコセニル、ヘキサコセニル、ヘプタコセニル、オクタコセニル、ノナコセニル、トリアコンテニル等があげられる。

R^{1b}におけるアルキニルとは、炭素数2～30個の直鎖または分枝鎖状のアルキニルであって、例えば、エチニル、プロピニル、イソプロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル、デシニル、ウンデシニル、ドデシニル、トリデシニル、テトラデシニル、ペンタデシニル、ヘキサデシニル、ヘプタデシニル、オクタデシニル、ノナデシニル、イコシニル、ヘンイコシニル、ドコシニル、トリコシニル、テトラコシニル、ペンタコシニル、ヘキサコシニル、ヘプタコシニル、オクタコシニル、ノナコシニル、トリアコンチニル等があげられる。

R^d、R^e、R^f、R^g、Rⁱ、R^k、R^sにおけるフェニルアルキルとは、

アルキル部の炭素数が1～30個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを有するフェニルアルキルであって、例えば、ベンジル、1-フェニルエチル、2-フェニルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、7-フェニルヘプチル、8-フェニルオクチル、9-フェニルノニル、10-フェニルデシル、11-フェニルウンデシル、12-フェニルドデシル、13-フェニルトリデシル、14-フェニルテトラデシル、15-フェニルペンタデシル、16-フェニルヘキサデシル、17-フェニルヘプタデシル、18-フェニルオクタデシル、19-フェニルノナデシル、20-フェニルイコシル、21-フェニルヘンイコシル、22-フェニルドコシル、23-フェニルトリコシル、24-フェニルテトラコシル、25-フェニルペンタコシル、26-フェニルヘキサコシル、27-フェニルヘプタコシル、28-フェニルオクタコシル、29-フェニルノナコシル、30-フェニルトリアコンチル等があげられる。

Re、Rf、Rg、Rhにおけるアルキル部の炭素数が6～20個であるフェニルアルキル、Rj、Rlにおけるアルキル部が炭素数2～6個のアルキルであるフェニルアルキルとは、上記フェニルアルキルの所定の炭素数のものを示す。

Rhにおけるアルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が6～20個であるフェニルアルコキシアルキルとは、例えば、5-フェニルメチルオキシペンチル、6-フェニルメチルオキシヘキシル、7-フェニルメチルオキシヘプチル、8-フェニルメチルオキシオクチル、9-フェニルメチルオキシノニル、10-フェニルメチルオキシデシル、12-フェニルメチルオキシドデシル、14-フェニルメチルオキシテトラデシル、16-フェニルメチルオキシヘキサデシル、18-フェニルメチルオキシオクタデシル、2-(8-フェニルオクチルオキシ)エチル、3-(8-フェニルオクチルオキシ)プロピル、4-(8-フェニルオクチルオキシ)ブチル、5-(8-フェニルオクチルオキシ)ペンチル、6-(8-フェニルオクチルオキシ)ヘキシル、7-(8-フェニルオクチルオキシ)ヘプチル等のフェニルアルコキシアルキル等があげられる。

Rhにおけるアルキル部の炭素数が6～20個であるフェノキシアルキルとは、

例えば、6-フェノキシヘキシル、7-フェノキシヘプチル、8-フェノキシオクチル、9-フェノキシノニル、10-フェノキシデシル、11-フェノキシウンデシル、12-フェノキシドデシル、13-フェノキシトリデシル、14-フェノキシテトラデシル、15-フェノキシペンタデシル、16-フェノシキヘキサデシル、17-フェノキシヘプタデシル、18-フェノキシオクタデシル、19-フェノキシノナデシル、20-フェノキシイコシル等があげられる。

Rh におけるアルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が6~20個であるフェノキシアルコキシアルキルとは、例えば、5-(2-フェノキシエチルオキシ)ペンチル、6-(2-フェノキシエチルオキシ)ヘキシル、7-(2-フェノキシエチルオキシ)ヘプチル、8-(2-フェノキシエチルオキシ)オクチル、5-(3-フェノキシプロピルオキシ)ペンチル、6-(3-フェノキシプロピルオキシ)ヘキシル、7-(3-フェノキシプロピルオキシ)ヘプチル、8-(3-フェノキシプロピルオキシ)オクチル、5-(4-フェノキシブチルオキシ)ペンチル、6-(4-フェノキシブチルオキシ)ヘキシル、7-(4-フェノキシブチルオキシ)ヘプチル、8-(4-フェノキシブチルオキシ)オクチル、5-(6-フェノキシヘキシルオキシ)ペンチル、6-(6-フェノキシヘキシルオキシ)ヘキシル、7-(6-フェノキシヘキシルオキシ)ヘプチル、8-(6-フェノキシヘキシルオキシ)オクチル等があげられる。

Rd、Re、Rf、Rg におけるシクロアルキルアルキルとは、アルキル部の炭素数が1~30個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、シクロアルキル部の炭素数が3~10個のシクロアルキルを有するものであって、例えば、シクロヘキシルメチル、1-シクロヘキシルエチル、2-シクロヘキシルエチル、1-シクロヘキシルプロピル、2-シクロヘキシルプロピル、3-シクロヘキシルプロピル、4-シクロヘキシルブチル、5-シクロヘキシルペンチル、6-シクロヘキシルヘキシル、7-シクロヘキシルヘプチル、8-シクロヘキシルオクチル、9-シクロヘキシルノニル、10-シクロヘキシルデシル、11-シクロヘキシルウンデシル、12-シクロヘキシルドデシル、13-シクロヘキシルトリデシル、14-シクロヘキシルテトラデシル、15-シクロヘキシルペンタデシ

ル、16-シクロヘキシルヘキサデシル、17-シクロヘキシルヘプタデシル、18-シクロヘキシルオクタデシル、19-シクロヘキシルノナデシル、20-シクロヘキシルイコシル、21-シクロヘキシルヘンイコシル、22-シクロヘキシルドコシル、23-シクロヘキシルトリコシル、24-シクロヘキシルテトラコシル、25-シクロヘキシルペンタコシル、26-シクロヘキシルヘキサコシル、27-シクロヘキシルヘプタコシル、28-シクロヘキシルオクタコシル、29-シクロヘキシルノナコシル、30-シクロヘキシルトリアコンチル等があげられる。

Re、Rf、Rgにおけるアルキル部の炭素数が6～20個であるシクロアルキルアルキルとは、上記シクロアルキルアルキルの所定の炭素数のものを示す。

Rmにおけるアルキル部の炭素数の総計が6～20個であるアルキル置換シクロアルキルアルキルとは、例えば、3-(4-ヘプチルシクロヘキシル)プロピル、4-(4-ブチルシクロヘキシル)ブチル、2-(4-オクチルシクロヘキシル)エチル、2-(4-ノニルシクロヘキシル)エチル、2-(4-ドデシルシクロヘキシル)エチル等があげられる。

Rd、Re、Rf、Rgにおけるヘテロアリールアルキルとは、アルキル部の炭素数が1～30個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを有するヘテロアリールアルキルであって、例えば、(チエニルまたはピリジル)メチル、1-(チエニルまたはピリジル)エチル、2-(チエニルまたはピリジル)エチル、1-(チエニルまたはピリジル)プロピル、2-(チエニルまたはピリジル)プロピル、3-(チエニルまたはピリジル)プロピル、4-(チエニルまたはピリジル)ブチル、5-(チエニルまたはピリジル)ペンチル、6-(チエニルまたはピリジル)ヘキシル、7-(チエニルまたはピリジル)ヘプチル、8-(チエニルまたはピリジル)オクチル、9-(チエニルまたはピリジル)ノニル、10-(チエニルまたはピリジル)デシル、11-(チエニルまたはピリジル)ウンデシル、12-(チエニルまたはピリジル)ドデシル、13-(チエニルまたはピリジル)トリデシル、14-(チエニルまたはピリジル)テトラデシル、15-(チエニルまたはピリジル)ペンタデシル、16-(チエニルまたはピリジル)ヘキサデシ

ル、17-（チエニルまたはピリジル）ヘプタデシル、18-（チエニルまたはピリジル）オクタデシル、19-（チエニルまたはピリジル）ノナデシル、20-（チエニルまたはピリジル）イコシル、21-（チエニルまたはピリジル）ヘンイコシル、22-（チエニルまたはピリジル）ドコシル、23-（チエニルまたはピリジル）トリコシル、24-（チエニルまたはピリジル）テトラコシル、25-（チエニルまたはピリジル）ペンタコシル、26-（チエニルまたはピリジル）ヘキサコシル、27-（チエニルまたはピリジル）ヘプタコシル、28-（チエニルまたはピリジル）オクタコシル、29-（チエニルまたはピリジル）ノナコシル、30-（チエニルまたはピリジル）トリアコンチル等のチエニルアルキルまたはピリジルアルキルがあげられる。

Re、Rf、Rgにおけるアルキル部の炭素数が6～20個のヘテロアリールアルキルとは、上記ヘテロアリールアルキルの所定の炭素数のものを示す。

R0におけるアルキル部の炭素数の総計が6～20個であるアルキル置換チエニルアルキルとは、例えば、2-（5-オクチル-2-チエニル）エチル、2-（5-ノニル-2-チエニル）エチル、2-（5-デシル-2-チエニル）エチル、2-（5-ドデシル-2-チエニル）エチル等があげられる。

R0におけるアルキル部の炭素数が6～20個であるチエニルアルキルとは、上記ヘテロアリールアルキルのうちのチエニルアルキルを示す。好ましくは13-（2-チエニル）トリデシル等である。

R0におけるアルキル部の炭素数の総計が6～20個であるアルキル置換ピリジルアルキルとは、例えば、2-（5-オクチル-2-ピリジル）エチル、2-（5-デシル-2-ピリジル）エチル、2-（2-オクチル-5-ピリジル）エチル、2-（2-デシル-5-ピリジル）エチル等があげられる。

R0におけるアルキル部の炭素数が6～20個であるピリジルアルキルとは、上記ヘテロアリールアルキルのうちのピリジルアルキルを示す。好ましくは13-（2-ピリジル）トリデシル、13-（3-ピリジル）トリデシル等である。

Rd、Re、Rf、Rgにおけるヘテロサイクリックアルキルとは、アルキル部の炭素数が1～30個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、ヘテロサイ

クリックとは、ヘテロアリールの脂環体であるヘテロサイクリックアルキルであって、例えば、4-ピペリジルメチル、1-(4-ピペリジル)エチル、2-(4-ピペリジル)エチル、1-(4-ピペリジル)プロピル、2-(4-ピペリジル)プロピル、3-(4-ピペリジル)プロピル、4-(4-ピペリジル)ブチル、5-(4-ピペリジル)ペンチル、6-(4-ピペリジル)ヘキシル、7-(4-ピペリジル)ヘプチル、8-(4-ピペリジル)オクチル、9-(4-ピペリジル)ノニル、10-(4-ピペリジル)デシル、11-(4-ピペリジル)ウンデシル、12-(4-ピペリジル)ドデシル、13-(4-ピペリジル)トリデシル、14-(4-ピペリジル)テトラデシル、15-(4-ピペリジル)ペンタデシル、16-(4-ピペリジル)ヘキサデシル、17-(4-ピペリジル)ヘプタデシル、18-(4-ピペリジル)オクタデシル、19-(4-ピペリジル)ノナデシル、20-(4-ピペリジル)イコシル、21-(4-ピペリジル)ヘンイコシル、22-(4-ピペリジル)ドコシル、23-(4-ピペリジル)トリコシル、24-(4-ピペリジル)テトラコシル、25-(4-ピペリジル)ペンタコシル、26-(4-ピペリジル)ヘキサコシル、27-(4-ピペリジル)ヘプタコシル、28-(4-ピペリジル)オクタコシル、29-(4-ピペリジル)ノナコシル、30-(4-ピペリジル)トリアコンチル等があげられる。

Re、Rf、Rgにおけるアルキル部の炭素数が6～20個のヘテロサイクリックアルキルとは、上記ヘテロサイクリックアルキルの所定の炭素数のものを示す。

Rnにおけるアルキル部の炭素数の総計が6～20個である1-アルキル置換ピペリジン-4-イルアルキルとは、例えば、2-(1-オクチルピペリジン-4-イル)エチル、2-(1-ドデシルピペリジン-4-イル)エチル等があげられる。

R、R^{1b}、R^d、R^m、Rⁿ、R^o、R^vにおける置換基としてのアルキルとは、炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノ

ニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル、ノナデシル、イコシル等があげられる。

Re、Rfにおける置換基としての炭素数6～20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、Rg、Ri、Rj、Rsにおける置換基としての炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、Rp、Rqにおける置換基としての炭素数が6～18個であるアルキル、Ru、Rwにおける置換基としての炭素数が4～16個であるアルキルとは、上記アルキルの所定の炭素数のものを示す。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアルコキシとは、炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルコキシであって、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、第2級ブトキシ、第3級ブトキシ、ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、第3級ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヘプチルオキシ、オクチルオキシ、ノニルオキシ、デシルオキシ、ウンデシルオキシ、ドデシルオキシ、トリデシルオキシ、テトラデシルオキシ、ペンタデシルオキシ、ヘキサデシルオキシ、ヘプタデシルオキシ、オクタデシルオキシ、ノナデシルオキシ、イコシルオキシ等があげられる。

Re、Rfにおける置換基としての炭素数6～20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシ、Rg、Ri、Rj、Rsにおける置換基としての炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシとは、上記アルコキシの所定の炭素数のものを示す。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアルケニルオキシとは、そのアルケニル部が炭素数2～20個の直鎖または分枝鎖状のアルケニルであって、例えば、ビニルオキシ、プロペニルオキシ、イソプロペニルオキシ、ブテニルオキシ、イソブテニルオキシ、ペンテニルオキシ、イソペンテニルオキシ、ヘキセニルオキシ、ヘプテニルオキシ、オクテニルオキシ、ノネニルオキシ、デセニルオキシ、ウンデセニルオキシ、ドデセニルオキシ、トリデセニルオキシ、テトラデセニルオキシ、ペンタデセニルオキシ、ヘ

キサデセニルオキシ、ヘプタデセニルオキシ、オクタデセニルオキシ、ノナデセニルオキシ、イコセニルオキシ等があげられる。

Re、Rfにおける置換基としての炭素数6～20個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、Rg、Ri、Rj、Rsにおける置換基としての炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシとは、上記アルケニルオキシの所定の炭素数のものを示す。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアルキニルオキシとは、そのアルキニル部が炭素数2～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキニルであって、例えば、エチニルオキシ、プロピニルオキシ、ブチニルオキシ、ペンチニルオキシ、ヘキシニルオキシ、ヘプチニルオキシ、オクチニルオキシ、ノニニルオキシ、デシニルオキシ、ウンデシニルオキシ、ドデシニルオキシ、トリデシニルオキシ、テトラデシニルオキシ、ペンタデシニルオキシ、ヘキサデシニルオキシ、ヘプタデシニルオキシ、オクタデシニルオキシ、ノナデシニルオキシ、イコシニルオキシ等があげられる。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアラルキルオキシにおけるアラルキルとは、アルキル部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであるアラルキルであって、例えば、ベンジルオキシ、2-フェネチルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、7-フェニルヘプチルオキシ、8-フェニルオクチルオキシ、9-フェニルノニルオキシ、10-フェニルデシルオキシ、11-フェニルウンデシルオキシ、12-フェニルドデシルオキシ、13-フェニルトリデシルオキシ、14-フェニルテトラデシルオキシ等のフェニルアルコキシ、ナフチルメチル、2-ナフチルエチル等のナフチルアルコキシ等があげられる。好ましくはフェニルアルコキシである。

Re、Rf、Rg、Rkにおける置換基としてのフェニルアルコキシとは、上記アラルキルオキシにおけるフェニルアルコキシを示す。

R1 における置換基としてのアルコキシ部の炭素数が2～8個であるフェニルアルコキシとは、上記アラルキルオキシにおけるフェニルアルコキシの所定の炭素数のものを示す。

R、R¹、R^{1a}、R^d、R^t、R^v における置換基としてのアルキレンジオキシとは、そのアルキレン部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキレンであるアルキレンジオキシであって、例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、プロピレンジオキシ、トリメチレンジオキシ、ブチレンジオキシ、1,2-ジメチルエチレンジオキシ、ペンタメチレンジオキシ、ヘキサメチレンジオキシ、ヘプタメチレンジオキシ、オクタメチレンジオキシ、ノナメチレンジオキシ、デカメチレンジオキシ、ウンデカメチレンジオキシ、ドデカメチレンジオキシ、トリデカメチレンジオキシ、テトラデカメチレンジオキシ、ペンタデカメチレンジオキシ、ヘキサデカメチレンジオキシ、ヘプタデカメチレンジオキシ、オクタデカメチレンジオキシ、ノナデカメチレンジオキシ、イコサメチレンジオキシ等があげられる。好ましくはメチレンジオキシ、エチレンジオキシ等である。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、R^a、R^d、R^e、R^f、R^t、R^v における置換基としてのアシルとは置換基を有していてもよいアルカノイルあるいはアロイルを意味し、アルカノイルとは炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルカノイルであって、例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、ウンデカノイル、ドデカノイル、トリデカノイル、テトラデカノイル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、ヘプタデカノイル、オクタデカノイル、ノナデカノイル、イコサノイル等があげられ、また、これらは置換基としてフェニルを有していてもよく、例えばフェニルアセチル、フェニルプロピオニル等があげられる。また、アロイルとしてはベンゾイル等があげられる。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、R^a、R^d、R^e、R^f、R^t、R^v における置換基としてのアルキルアミノとは、そのアルキル部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、第2級ブチル

アミノ、第3級ブチルアミノ、ペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、第3級ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ヘプチルアミノ、オクチルアミノ、ノニルアミノ、デシルアミノ、ウンデシルアミノ、ドデシルアミノ、トリデシルアミノ、テトラデシルアミノ、ペンタデシルアミノ、ヘキサデシルアミノ、ヘプタデシルアミノ、オクタデシルアミノ、ノナデシルアミノ、イコシルアミノ等があげられる。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアルキルチオとは、そのアルキル部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、第2級ブチルチオ、第3級ブチルチオ、ペンチルチオ、イソペンチルチオ、第3級ペンチルチオ、ヘキシルチオ、ヘプチルチオ、オクチルチオ、ノニルチオ、デシルチオ、ウンデシルチオ、ドデシルチオ、トリデシルチオ、テトラデシルチオ、ペンタデシルチオ、ヘキサデシルチオ、ヘプタデシルチオ、オクタデシルチオ、ノナデシルチオ、イコシルチオ等があげられる。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアシルアミノとは、そのアシル部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルカノイルであって、例えば、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、ピバロイルアミノ、ヘキサノイルアミノ、ヘプタノイルアミノ、オクタノイルアミノ、ノナノイルアミノ、デカノイルアミノ、ウンデカノイルアミノ、ドデカノイルアミノ、トリデカノイルアミノ、テトラデカノイルアミノ、ペンタデカノイルアミノ、ヘキサデカノイルアミノ、ヘプタデカノイルアミノ、オクタデカノイルアミノ、ノナデカノイルアミノ、イコサノイルアミノ等があげられる。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアルコキシカルボニルとは、そのアルコキシ部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状で、置換基を有していてもよいアルコキシであって、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、第3級ブトキ

シカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、イソペンチルオキシカルボニル、第3級ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、ヘプチルオキシカルボニル、オクチルオキシカルボニル、ノニルオキシカルボニル、デシルオキシカルボニル、ウンデシルオキシカルボニル、ドデシルオキシカルボニル、トリデシルオキシカルボニル、テトラデシルオキシカルボニル、ペンタデシルオキシカルボニル、ヘキサデシルオキシカルボニル、ヘプタデシルオキシカルボニル、オクタデシルオキシカルボニル、ノナデシルオキシカルボニル、イコシルオキシカルボニル等があげられ、また、これらは置換基としてフェニルを有していてもよく、例えばベンジルオキシカルボニル等があげられる。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアルコキシカルボニルアミノとは、そのアルコキシ部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状で、置換基を有していてもよいアルコキシであって、例えば、メトキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニルアミノ、プロポキシカルボニルアミノ、イソプロポキシカルボニルアミノ、ブトキシカルボニルアミノ、イソブトキシカルボニルアミノ、第3級ブトキシカルボニルアミノ、ペンチルオキシカルボニルアミノ、イソペンチルオキシカルボニルアミノ、第3級ペンチルオキシカルボニルアミノ、ヘキシルオキシカルボニルアミノ、ヘプチルオキシカルボニルアミノ、オクチルオキシカルボニルアミノ、ノニルオキシカルボニルアミノ、デシルオキシカルボニルアミノ、ウンデシルオキシカルボニルアミノ、ドデシルオキシカルボニルアミノ、トリデシルオキシカルボニルアミノ、テトラデシルオキシカルボニルアミノ、ペンタデシルオキシカルボニルアミノ、ヘキサデシルオキシカルボニルアミノ、ヘプタデシルオキシカルボニルアミノ、オクタデシルオキシカルボニルアミノ、ノナデシルオキシカルボニルアミノ、イコシルオキシカルボニルアミノ等があげられ、また、これらは置換基としてフェニルを有していてもよく、例えばベンジルオキシカルボニルアミノ等があげられる。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、Ra、Rd、Re、Rf、Rt、Rvにおける置換基としてのアシルオキシとは、そのアシル部が炭素数2～20個の直鎖または分枝鎖状のアルカノイルであって、例えば、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチ

リルオキシ、イソブチリルオキシ、ピバロイルオキシ、ペンタノイルオキシ、ヘキサノイルオキシ、ヘプタノイルオキシ、オクタノイルオキシ、ノナノイルオキシ、デカノイルオキシ、ウンデカノイルオキシ、ドデカノイルオキシ、トリデカノイルオキシ、テトラデカノイルオキシ、ペンタデカノイルオキシ、ヘキサデカノイルオキシ、ヘプタデカノイルオキシ、オクタデカノイルオキシ、ノナデカノイルオキシ、イコサノイルオキシ等があげられる。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、R_a、R_d、R_e、R_f、R_t、R_vにおける置換基としてのアルキルカルバモイルとは、そのアルキル部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、プロピルカルバモイル、ブチルカルバモイル、ペンチルカルバモイル、ヘキシルカルバモイル、ヘプチルカルバモイル、オクチルカルバモイル、ノニルカルバモイル、デシルカルバモイル、ウンデシルカルバモイル、ドデシルカルバモイル、トリデシルカルバモイル、テトラデシルカルバモイル、ペンタデシルカルバモイル、ヘキサデシルカルバモイル、ヘプタデシルカルバモイル、オクタデシルカルバモイル、ノナデシルカルバモイル、イコシルカルバモイル等があげられる。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、R_d、R_t、R_vにおける置換基としてのハロアルキルとは、そのアルキル部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、フルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、パーフルオロエチル、3-クロロプロピル、3-フルオロプロピル、4-クロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、6-クロロヘキシル、6-フルオロヘキシル、7-クロロヘプチル、7-フルオロヘプチル、8-フルオロオクチル、9-フルオロノニル、10-フルオロデシル、11-フルオロウンデシル、12-フルオロドデシル、13-フルオロトリデシル、14-フルオロテトラデシル、15-フルオロペンタデシル、16-フルオロヘキサデシル、17-フルオロヘプタデシル、18-フルオロオクタデシル、19-フルオロノナデシル、20-フルオロイコシル等があげられる。

R、R¹、R_d、R_t、R_vにおける置換基としてのハロアルコキシとは、炭

素数 1～20 個のハロアルコキシであって、たとえば、クロロメトキシ、ブロメトキシ、フルオロメトキシ、ジクロロメトキシ、ジブロメトキシ、ジフルオロメトキシ、2-クロロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、3-クロロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロポキシ、4-クロロブトキシ、4-フルオロブトキシ、5-クロロペンチルオキシ、5-フルオロペンチルオキシ、6-クロロヘキシルオキシ、6-フルオロヘキシルオキシ、7-クロロヘプチルオキシ、7-フルオロヘプチルオキシ、8-フルオロオクチルオキシ、9-フルオロノニルオキシ、10-フルオロデシルオキシ、11-フルオロウンデシルオキシ、12-フルオロドデシルオキシ、13-フルオロトリデシルオキシ、14-フルオロテトラデシルオキシ、15-フルオロペンタデシルオキシ、16-フルオロヘキサデシルオキシ、17-フルオロヘプタデシルオキシ、18-フルオロオクタデシルオキシ、19-フルオロノナデシルオキシ、20-フルオロイコシルオキシ等があげられる。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、R_a、R_b、R_c、R_d、R_e、R_f、R_g、R_i、R_j、R_s、R_t、R_v における置換基としてのハロゲンとは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素があげられる。

R、R¹、R_t における置換基としてのアリールとしては、フェニル、ナフチル等があげられる。好ましくはフェニルである。

R、R¹、R_t における置換基としてのアリールオキシとしては、フェノキシ、ナフチルオキシ等があげられる。好ましくはフェノキシである。

R、R¹、R^{1a}、R^{1b}、R_t における置換基としてのシクロアルキルとは、炭素数 3～10 個のシクロアルキルであって、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル等があげられる。好ましくはシクロヘキシルである。

R、R¹、R_t における置換基としてのヘテロアリールは 1～4 個のヘテロ原子（窒素原子、酸素原子、硫黄原子から選ばれる）を環中に含んでもよい 5～6 員のヘテロアリールであって、たとえば、チエニル（2-チエニル、3-チ

エニル)、フリル(2-フリル、3-フリル)、ピロリル(1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル)、イミダゾリル(2-イミダゾリル、4-イミダゾリル等)、ピラゾリル(3-ピラゾリル、4-ピラゾリル等)、トリアゾリル、テトラゾリル、チアゾリル(2-チアゾリル、4-チアゾリル等)、イソチアゾリル(3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル等)、オキサゾリル(2-オキサゾリル、4-オキサゾリル等)、イソオキサゾリル(3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル等)、ピリジル(2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル)、ピラジニル、ピリミジニル(2-ピリミジニル、4-ピリミジニル等)、ピリダジニル(3-ピリダジニル、4-ピリダジニル等)、ピラニル(2-ピラニル、3-ピラニル、4-ピラニル)等の単環式ヘテロアリール、インドリル(2-インドリル、3-インドリル)、キノリル(2-キノリル、3-キノリル)、イソキノリル(1-イソキノリル、3-イソキノリル)、ベンゾフラニル(2-ベンゾフラニル、3-ベンゾフラニル)、ベンゾチエニル(2-ベンゾチエニル、3-ベンゾチエニル)、1H-ベンズイミダゾール-2-イル、クロメニル(2-クロメニル、3-クロメニル、4-クロメニル)等の二環式ヘテロアリール等があげられる。

R、R¹、R^tにおける置換基としての上記ヘテロアリールの脂環体は、上記単環式ヘテロアリールが飽和されているものであって、たとえば、ピロリジニル(1-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル)、ピペリジル(2-ピペリジル、3-ピペリジル、4-ピペリジル)、ピペリジノ、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル等があげられる。

R^{1a}における置換基としての炭素鎖とは、炭素数1~30個の直鎖または分枝鎖状の炭素鎖であり、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、第3級ブチル、ペンチル、イソペンチル、第3級ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル、ノナデシル、イコシル、ヘンイコシル、ドコシル、トリコシル、テトラコシル、ペンタコシル、ヘキサコシル、ヘプタコシル、オクタコシル、ノナコシル、

トリアコンチル等があげられる。

R^{1b}における置換基としてのアルケニルとは、炭素数2～20個の直鎖または分枝鎖状のアルケニルであって、例えば、エテニル、プロペニル、イソプロペニル、ブテニル、イソブテニル、ペンテニル、イソペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル、デセニル、ウンデセニル、ドデセニル、トリデセニル、テトラデセニル、ペンタデセニル、ヘキサデセニル、ヘプタデセニル、オクタデセニル、ノナデセニル、イコセニル等があげられる。

R^{1b}における置換基としてのアルキニルとは、炭素数2～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキニルであって、例えば、エチニル、プロピニル、イソプロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル、デシニル、ウンデシニル、ドデシニル、トリデシニル、テトラデシニル、ペンタデシニル、ヘキサデシニル、ヘプタデシニル、オクタデシニル、ノナデシニル、イコシニル等があげられる。

R^dにおける置換基としてのハロアラルキルオキシとは、アルキル部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであるアラルキルを有するハロアラルキルオキシであって、例えば、4-フルオロベンジルオキシ、2-(4-フルオロフェニル)エチルオキシ、1-(4-フルオロフェニル)エチルオキシ、1-(4-フルオロフェニル)プロピルオキシ、2-(4-フルオロフェニル)プロピルオキシ、3-(4-フルオロフェニル)プロピルオキシ、4-(4-フルオロフェニル)ブチルオキシ、5-(4-フルオロフェニル)ペンチルオキシ、6-(4-フルオロフェニル)ヘキシルオキシ、7-(4-フルオロフェニル)ヘプチルオキシ、8-(4-フルオロフェニル)オクチルオキシ、9-(4-フルオロフェニル)ノニルオキシ、10-(4-フルオロフェニル)デシルオキシ、11-(4-フルオロフェニル)ウンデシルオキシ、12-(4-フルオロフェニル)ドデシルオキシ、13-(4-フルオロフェニル)トリデシルオキシ、14-(4-フルオロフェニル)テトラデシルオキシ等のハロフェニルアルコキシ、(7-フルオロ-2-ナフチル)メチルオキシ、2-(7-フルオロ-2-ナフチル)エチルオキシ等のハロナフチルアルコキシ等があげられる。好ましくはハ

ロフェニルアルコキシである。

Re、Rf、Rg、Rk における置換基としてのハロフェニルアルコキシとは、上記ハロアラルキルオキシにおけるハロフェニルアルコキシを示す。

Rl における置換基としてのアルコキシ部の炭素数が2～8個であるハロフェニルアルコキシとは、上記ハロアラルキルオキシにおけるハロフェニルアルコキシの所定の炭素数のものを示す。

Rd における置換基としてのアラルキルオキシアルキルとは、アルキル部およびアラルキルのアルキル部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、その両アルキル部の炭素数の総計が2～20個であるアラルキルオキシアルキルであって、例えば、フェニルメチルオキシメチル、2-フェニルエチルオキシメチル、3-フェニルプロピルオキシメチル、4-フェニルブチルオキシメチル、5-フェニルペンチルオキシメチル、6-フェニルヘキシルオキシメチル、7-フェニルヘプチルオキシメチル、8-フェニルオクチルオキシメチル、9-フェニルノニルオキシメチル、10-フェニルデシルオキシメチル、12-フェニルドデシルオキシメチル、14-フェニルテトラデシルオキシメチル、16-フェニルヘキサデシルオキシメチル、18-フェニルオクタデシルオキシメチル等のフェニルアルコキシアルキル、4-(2-ナフチル)ブチルオキシメチル、5-(2-ナフチル)ペンチルオキシメチル、6-(2-ナフチル)ヘキシルオキシメチル等のナフチルアルコキシアルキル等があげられる。好ましくはフェニルアルコキシアルキルである。

Re、Rf、Rg、Rk における置換基としてのフェニルアルコキシアルキルとは、上記アラルキルオキシアルキルにおけるフェニルアルコキシアルキルを示す。

Rl における置換基としてのアルコキシ部およびアルキル部の総炭素数が2～8個であるフェニルアルコキシアルキルとは、上記アラルキルオキシアルキルにおけるフェニルアルコキシアルキルの所定の炭素数のものを示す。なお、アルコキシ部およびアルキル部のそれぞれの炭素数は、1～7個であって、総炭素数が2～8個である。

Rd、Re、Rf、Rg、Rk における置換基としてのフェノキシアルキルとは、アルキル部が炭素数 1～20 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであるフェノキシアルキルであって、例えば、フェノキシメチル、1-フェノキシエチル、2-フェノキシエチル、1-フェノキシプロピル、2-フェノキシプロピル、3-フェノキシプロピル、4-フェノキシブチル、5-フェノキシペンチル、6-フェノキシヘキシル、7-フェノキシヘプチル、8-フェノキシオクチル、9-フェノキシノニル、10-フェノキシデシル、11-フェノキシウンデシル、12-フェノキシドデシル、13-フェノキシトリデシル、14-フェノキシテトラデシル、15-フェノキシペンタデシル、16-フェノキシヘキサデシル、17-フェノキシヘプタデシル、18-フェノキシオクタデシル、19-フェノキシノナデシル、20-フェノキシイコシル等があげられる。

Rl における置換基としてのアルキル部の炭素数が 2～8 個であるフェノキシアルキルとは、上記フェノキシアルキルの所定の炭素数のものを示す。

Rd、Re、Rf、Rg、Rk における置換基としてのフェノキシアルコキシとは、アルコキシ部が炭素数 1～20 個の直鎖または分枝鎖状のアルコキシであるフェノキシアルコキシであって、例えば、フェノキシメトキシ、1-フェノキシエチルオキシ、2-フェノキシエチルオキシ、1-フェノキシプロピルオキシ、2-フェノキシプロピルオキシ、3-フェノキシプロピルオキシ、4-フェノキシブチルオキシ、5-フェノキシペンチルオキシ、6-フェノキシヘキシルオキシ、7-フェノキシヘプチルオキシ、8-フェノキシオクチルオキシ、9-フェノキシノニルオキシ、10-フェノキシデシルオキシ、11-フェノキシウンデシルオキシ、12-フェノキシドデシルオキシ、13-フェノキシトリデシルオキシ、14-フェノキシテトラデシルオキシ、15-フェノキシペンタデシルオキシ、16-フェノキシヘキサデシルオキシ、17-フェノキシヘプタデシルオキシ、18-フェノキシオクタデシルオキシ、19-フェノキシノナデシルオキシ、20-フェノキシイコシルオキシ等があげられる。

Rl における置換基としてのアルコキシ部の炭素数が 2～8 個であるフェノキシアルコキシとは、上記フェノキシアルコキシの所定の炭素数のものを示す。

R^2 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 、 R^3 、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^4 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^5 、 R^{5a} 、 R^{5b} 、 R^6 におけるアルキルとは、炭素数 1～20 個のアルキルであり、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、第 3 級ブチル、ペンチル、イソペンチル、第 3 級ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル、ノナデシル、イコシル等があげられる。

R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 におけるアラルキルとは、アルキル部の炭素数が 1～20 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを有するアラルキルであって、例えば、ベンジル、1-フェニルエチル、2-フェニルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、7-フェニルヘプチル、8-フェニルオクチル、9-フェニルノニル、10-フェニルデシル、11-フェニルウンデシル、12-フェニルドデシル、13-フェニルトリデシル、14-フェニルテトラデシル、15-フェニルペンタデシル、16-フェニルヘキサデシル、17-フェニルヘプタデシル、18-フェニルオクタデシル、19-フェニルノナデシル、20-フェニルイコシル等があげられる。

R^2 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^4 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^5 、 R^{5a} 、 R^{5b} 、 R^6 におけるアシルとは、置換基を有していてもよいアルカノイルあるいはアロイルを意味し、アルカノイルとは炭素数 1～20 個の直鎖または分枝鎖状のアルカノイルであって、例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、ウンデカノイル、ドデカノイル、トリデカノイル、テトラデカノイル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、ヘプタデカノイル、オクタデカノイル、ノナデカノイル、イコサノイル等があげられ、また、これらは置換基としてフェニルを有していてもよく、例えばフェニルアセチル、フェニルプロピオニル等があげられる。また、アロイルとしてはベンゾイル等があげられる。

R^2 、 R^{2a} 、 R^3 、 R^{3a} 、 R^4 、 R^{4a} 、 R^5 、 R^{5a} 、 R^6 におけるアルコキシ

カルボニルとは、そのアルコキシ部が炭素数1～20個の直鎖または分枝鎖状で、置換基を有していてもよいアルコキシであって、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、第3級ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、イソペンチルオキシカルボニル、第3級ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、ヘプチルオキシカルボニル、オクチルオキシカルボニル、ノニルオキシカルボニル、デシルオキシカルボニル、ウンデシルオキシカルボニル、ドデシルオキシカルボニル、トリデシルオキシカルボニル、テトラデシルオキシカルボニル、ペンタデシルオキシカルボニル、ヘキサデシルオキシカルボニル、ヘプタデシルオキシカルボニル、オクタデシルオキシカルボニル、ノナデシルオキシカルボニル、イコシルオキシカルボニル等があげられ、また、これらは置換基としてフェニルを有していてもよく、例えばベンジルオキシカルボニル等があげられる。

R^4 、 R^5 が結合するアルキレン鎖とは、炭素数が1～5個の直鎖または分枝鎖状のアルキレンであって、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、プロピレン、ブチレン、1, 2-ジメチルエチレン、ペンタメチレン等があげられる。

R^4 、 R^5 の置換基としてのアルキルとは、炭素数1～5個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであって、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、第2級ブチル、第3級ブチル、ペンチル等があげられる。

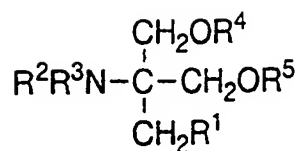
R^4 、 R^5 の置換基としてのアリールとは、フェニル、ナフチル等があげられる。

R^4 、 R^5 の置換基としてのアラルキルとは、アルキル部が炭素数1～5個の直鎖または分枝鎖状のアルキルであるアラルキルであって、例えば、ベンジル、2-フェネチル、1-フェニルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル等があげられる。

R^4 、 R^5 がアルキル、アリールまたはアラルキルにより置換されたアルキレン鎖とは、好ましくはエチリデン、イソプロピリデン、ベンジリデン、2-フェ

ニルエチリデン等があげられる。

本発明の好ましい化合物を以下の表に示す。



R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H
CH(CH ₃)C ₂ H ₅	H	H	H	H
CH(CH ₃)C ₃ H ₇	H	H	H	H
C(CH ₃) ₃	H	H	H	H
C(CH ₃) ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	H
C(CH ₃) ₂ C ₃ H ₇	H	H	H	H
C ₅ H ₁₁	H	H	H	H
C ₅ H ₁₁	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
C ₇ H ₁₅	H	H	H	H
C ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₉ H ₁₉	H	H	H	H
C ₉ H ₁₉	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
C ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
C ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
[CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂] ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H
[CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂] ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
C ₁₂ H ₂₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
C ₁₃ H ₂₇	CH ₃	CH ₃	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
C ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
C ₁₄ H ₂₉	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
C ₁₆ H ₃₃	H	H	H	H
C ₁₇ H ₃₅	H	H	H	H
C ₁₇ H ₃₅	C ₂ H ₅	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
C ₁₇ H ₃₅	H	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₁₇ H ₃₅	COC ₄ H ₉	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₁₇ H ₃₅	COC ₄ H ₉	H	H	H
C ₁₇ H ₃₅	C ₅ H ₁₁	H	H	H
C ₁₇ H ₃₅	COC ₉ H ₁₉	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₁₇ H ₃₅	COC ₉ H ₁₉	H	H	H
C ₁₇ H ₃₅	C ₁₀ H ₂₁	H	H	H
C ₁₇ H ₃₅	CH ₃	CH ₃	COCH ₃	COCH ₃
C ₁₇ H ₃₅	CH ₃	CH ₃	H	H
C ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H
C ₁₉ H ₃₉	H	H	H	H
C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
C ₂₁ H ₄₃	H	H	H	H
C ₂₂ H ₄₅	H	H	H	H
C ₂₃ H ₄₇	H	H	H	H
C ₂₄ H ₄₉	H	H	H	H
C ₂₅ H ₅₁	H	H	H	H
C ₂₆ H ₅₃	H	H	H	H
C ₂₇ H ₅₅	H	H	H	H
C ₂₈ H ₅₇	H	H	H	H
C ₂₉ H ₅₉	H	H	H	H
CH=CH ₂	H	H	H	H
CH=CHCH ₃	H	H	H	H
CH=CHC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
CH=CHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH=CHC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
CH=CHC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
CH=CHC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
CH=CHC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
CH=CHC ₁₇ H ₃₅	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH=CHC ₂₇ H ₅₅	H	H	H	H
CH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₁₆ H ₃₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHC ₂₆ H ₅₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
trans: (CH ₂) ₂ CH=CHC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
cis: (CH ₂) ₂ CH=CHC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH=CHC ₂₅ H ₅₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C(CH ₃)=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH=CHC ₂₄ H ₄₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CHC ₂₃ H ₄₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH=CHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH=CHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH=CHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH=CHC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH=CHC ₂₂ H ₄₆	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH(C ₂ H ₅)(CH ₂) ₃ CH=CHC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₆ CH=CHC ₂₁ H ₄₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ CH=CHC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH=CHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH=CHC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH=CHC ₁₉ H ₃₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(C ₃ H ₇)(CH ₂) ₆ CH=CHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ CH=CHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ CH=CHC ₁₇ H ₃₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ CH=CHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ CH=CHC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ C(CH ₃)=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH=CHC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₆ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₆ CH=CHC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₀ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₂ CH=CHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₄ CH=CHC ₃ H ₇	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂₆ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
[CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₂] ₃ -H	H	H	H	H
[CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₂] ₃ -H	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
C≡CH	H	H	H	H
C≡CCH ₃	H	H	H	H
C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
C≡CC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
C≡CC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
C≡CC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
C≡CC ₁₂ H ₂₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
C≡CC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
C≡CC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
C≡CC ₁₇ H ₃₅	H	H	H	H
C≡CC ₂₇ H ₅₅	H	H	H	H
CH ₂ C≡CH	H	H	H	H
CH ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₁₆ H ₃₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡CC ₂₆ H ₅₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡CC ₂₅ H ₅₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)C≡CC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡CC ₂₄ H ₄₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C≡CC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C≡CC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C≡CC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C≡CC ₂₃ H ₄₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C≡CCH ₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₅ C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C≡CC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C≡CC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C≡CC ₂₂ H ₄₆	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ C≡CC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ C≡CC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ C≡CC ₂₁ H ₄₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C≡CC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C≡CC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ C≡CC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ C≡CC ₁₉ H ₃₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)(CH ₂) ₆ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₀ C≡CC ₁₇ H ₃₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ C≡CC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ C≡CC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₆ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₆ C≡CC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₈ C≡CC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₀ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₂ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₄ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₆ C≡CCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OH	H	H	H	H
CH ₂ (OH)CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₆ H ₁₃)OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₆ H ₁₃)OH	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₇ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ OH	H	H	H	H
COOH	H	H	H	H
CH ₂ COOH	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ COOH	H	H	H	H
CH ₂ COOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ COOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ COOC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ COOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ COOC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ COOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ COOC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ COOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ COOC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ COOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₆ COOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ COOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(C ₄ H ₉)COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ COOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ COOC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ COOCH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₀ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ COOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ COOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ COOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ COOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ COOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ OCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
CH ₂ OCOC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCOC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₃ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCOC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ OCOC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ OCOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ OCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ OCOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ OCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH(C ₆ H ₁₃)OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OCOC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ OCOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₁ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ OCOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ OCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ OCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₃ OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₃ OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₃ OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₃ OCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
CH(CH ₃)OCOCH ₃	H	H	H	H
CH(CH ₃)OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH(CH ₃)OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
CH(CH ₃)OCOC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
CH ₂ COC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ COC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
CH ₂ COC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ COC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ COC ₆ H ₁₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ COC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
CH ₂ COC ₁₇ H ₃₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ SC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ SC ₁₂ H ₂₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)SCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)SC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)SC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ SCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ SC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ SC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₉ H ₁₉)SCH ₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ CH(C ₉ H ₁₉)SC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₉ H ₁₉)SC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ SCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ SC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ SC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₁₁ H ₂₃)SCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₁₁ H ₂₃)SC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₁₁ H ₂₃)SC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ SCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ SC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ SC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₁₅ H ₃₁)SCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₁₅ H ₃₁)SC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₁₅ H ₃₁)SC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₁₇ H ₃₅)SCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₁₇ H ₃₅)SC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₁₇ H ₃₅)SC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(C ₃ H ₇)NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₅ NH ₂	H	H	H	H
CH ₂ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ NHCOOC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHCOOC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHCOOC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHCOOC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHCOOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NHCOOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NHCOOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NHCOOC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHCOOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NHCOOC ₄ H ₉	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₇ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(C ₁₀ H ₂₁)NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ NHCOOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ NHCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
CH ₂ NHCOC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
CH ₂ NHCOC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHCOC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHCOC ₁₂ H ₂₆	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHCOC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHCOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₇ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NHCOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NHCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH(C ₄ H ₉)NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NHCOC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHCOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NHCOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NHCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NHCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ NHCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
CH(CH ₃)NHCOCH ₃	H	H	H	H
CH(CH ₃)NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH(CH ₃)NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
CH(CH ₃)NHCOC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
CH ₂ NHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
CH ₂ NHC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
CH ₂ NHC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NHC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NHC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NHC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NHC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NHC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₈ NHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH(C ₆ H ₁₃)NHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₃ NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₃ NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₃ NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₃ NHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CONHCH ₃	H	H	H	H
CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
COOC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
CH ₂ CONHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ CONHC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CONHCH ₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₃ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CONHC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CONHC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ CONHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CONHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ CONHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ CONHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ CONHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(C ₈ H ₁₇)CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂₉ CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH(C ₆ H ₁₃)NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ NO ₂	H	H	H	H
CH ₂ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ Cl	H	H	H	H
CH ₂ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ Br	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₄ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CHBrC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₉ Br	H	H	H	H
CH ₂ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₂ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ CHFC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₂ CHF ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ CHF ₂	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₂ CF ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ CF ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₄ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₇ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₃ F	H	H	H	H
CH ₂ OCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ OC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OC ₁₅ H ₃₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ OC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ OC ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₅ OC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ OC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ OC ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₆ OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₁₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₇ OC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ OC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ OC ₅ H ₁₁	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₈ OC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ OC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ OC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₅ OCH ₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ OCH ₂ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCH ₂ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCH ₂ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OCH ₂ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ OCH ₂ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OCH ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCH ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCH ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ OCH ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OCH ₂ CH=CHC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ CH(CH ₃)OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
CH ₂ OCH ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCH ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCH ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OCH ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ OCH ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OCH ₂ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCH ₂ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCH ₂ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ OCH ₂ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ OCH ₂ C≡CC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ O(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ O(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ O(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ O(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ O(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₆ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ OCH ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₇ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(C ₄ H ₉)O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₅ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₁₇ H ₃₅	CH ₃	H	H	H
C ₁₇ H ₃₅	CH ₃	CH ₃	H	H
C ₁₇ H ₃₅	C ₁₈ H ₃₇	H	H	H
C ₁₇ H ₃₅	C ₁₈ H ₃₇	C ₁₈ H ₃₇	H	H
C ₁₇ H ₃₅	COCH ₃	H	H	H
C ₁₇ H ₃₅	COC ₁₇ H ₃₅	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH(CH ₃)C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₅	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R^1	R^2	R^3	R^4	R^5
$C \equiv CC_6H_5$	H	H	H	H
$C \equiv CC_6H_5$	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
$(CH_2)_3C_6H_5$	H	H	H	H
$CH_2CH(CH_3)C_6H_5$	H	H	H	H
$CH_2CH(CH_3)C_6H_5$	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
$(CH_2)_4C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_5C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_5C_6H_5$	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
$(CH_2)_6C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_7C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_8C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_9C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_9C_6H_5$	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
$(CH_2)_9C_6H_{11}$	H	H	H	H
$(CH_2)_{11}C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_{12}C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_{12}C_6H_5$	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
$(CH_2)_{13}C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_{15}C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_{17}C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_{19}C_6H_5$	H	H	H	H
$(CH_2)_{29}C_6H_5$	H	H	H	H
$C_6H_4-3-CH_3$	H	H	H	H
$C_6H_4-4-CH_3$	H	H	H	H
$C_6H_4-3-C_2H_5$	H	H	H	H
$C_6H_4-4-C_2H_5$	H	H	H	H
$C_6H_4-3-C_3H_7$	H	H	H	H
$C_6H_4-2-C_3H_7$	H	H	H	H
$C_6H_4-4-C_3H_7$	H	H	H	H
$C_6H_4-3-C_4H_9$	H	H	H	H
$C_6H_4-4-C_4H_9$	H	H	H	H
$C_6H_4-3-C_6H_{13}$	H	H	H	H
$C_6H_4-4-C_9H_{19}$	H	H	H	H
$C_6H_4-4-C_9H_{19}$	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
C ₆ H ₁₀ -3-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₃ H ₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₄ H ₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-C ₄ H ₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃) ₂	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	CH ₃	CH ₃	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₃ H ₇	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -2-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -2-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -2-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₁₀ -4-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-C ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ CH=C(C ₃ H ₇)C ₆ H ₁₀ -4-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-C ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-C ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -3-C ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-C ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -3-CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -2-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₂ H ₅)-C ₅ H ₈ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH=CH(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH=CHCH ₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH=CHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -3-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-CH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH=CHC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-C≡CH	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-C≡CH	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-C≡CH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C≡CH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C≡CH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-C≡CCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-C≡CCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₆ C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-(CH ₂) ₃ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₃ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₃ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-C≡CCH ₃	H	H	H	H
CH(C ₂ H ₅)C ₆ H ₄ -4-C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₄ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -2-C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -2-(CH ₂) ₃ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₃ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₈ -4-(CH ₂) ₈ C≡CH	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₅ H ₈ -4-(CH ₂) ₈ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -2-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -2-C≡CH	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH(C ₂ H ₅)C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₂ C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-CH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(C ₃ H ₇)C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₅ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₈ H ₁₂ -4-(CH ₂) ₄ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
C≡C(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-C≡CC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
C ₆ H ₄ -2-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -3-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₆ H ₄ -3-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
C ₆ H ₄ -3-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₅ H ₁₁	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ CH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ CH=CH ₂	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₉ H ₁₉	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₉ H ₁₉	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₅ H ₈ -3-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -2-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₅ H ₁₁	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -2-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₄ -5-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -3-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -2-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
C≡C(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
C≡C(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -3-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₁₂ H ₂₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-OC ₂₀ H ₄₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-OCH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-OC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -2-OC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-OC ₅ H ₁₁	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-OC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -3-OC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-OC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -3-OCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-OCH=CH ₂	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OCH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₇ CH=CHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ CH=CHC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ CH=CHC ₄ H ₉	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-OC≡CH	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OC≡CH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OC≡CH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OC≡CH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₄ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₅ H ₈ -2-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₆ C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₂ C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₇ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -2-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₂ C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH(C ₂ H ₅)C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ CH(C ₂ H ₅)C ₆ H ₁₀ -4-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₅ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C≡CC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₅ C≡CC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C≡C(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₇ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH(C ₃ H ₇)C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₃ C≡CC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -3-OCH ₂ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡C(CH ₂) ₆ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -2-O(CH ₂) ₂ C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₂ C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ C≡CH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₂ C≡CC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ CH=CH(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₂ C≡CC ₆ H ₁₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₈ C≡CH	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -2-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₁₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₁₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -2-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ CH(C ₂ H ₅)C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ CH(C ₂ H ₅)C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡C(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ CH(C ₂ H ₅)C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₁₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ CH(C ₂ H ₅)C ₆ H ₁₀ -4-O(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C≡C(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-COCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-COC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-COC ₅ H ₁₁	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
C ₆ H ₁₀ -4-COC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-COC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-COCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -2-COCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-COCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -3-COCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-COCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-COC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-COC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-COC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-COCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-COCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-COC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -2-COC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-COC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-COC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-COC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-COC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-COC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-COC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-COCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-COC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-COC ₉ H ₁₉	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-COC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-COC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COC ₁₇ H ₃₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COC ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-NHCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-NHCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₉ H ₁₉	COOC(CH ₃) ₃	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NHCOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NHCOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-NHCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCOCH ₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-NHCOC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₁₇ H ₃₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -2-OCOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OCOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-OCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OCOC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-OCOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-OCOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-OCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-OCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-OCOC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -2-OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -3-OCOCH ₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-OCOC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-OCOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-OCOC ₉ H ₁₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-OCOC ₁₃ H ₂₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₁₇ H ₃₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OCOC ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-COOC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-COOC ₄ H ₉	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -2-COOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -3-COOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-COOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-COOC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-COOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-COOC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-COOC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -2-COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -3-COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-COOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-COOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-COOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-COOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-COOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-COOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-COOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-COOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-COOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-COOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-COOC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COOC ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -2-COOC ₁₉ H ₃₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -3-COOC ₁₉ H ₃₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COOC ₁₉ H ₃₉	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -2-NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₄ H ₉	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -2-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NHCOOC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NHCOOC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₇ -4-NHCOOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCOOCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-NHCOOC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHCOOC ₁₉ H ₃₉	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHC ₄ H ₉	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-NHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NHC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-NHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-N(CH ₃)C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-N(CH ₃)C ₁₀ H ₂₁	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-NHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -2-NHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₄ -4-NHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-NHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-NHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-NHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-NHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-NHC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHC ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NHC ₁₉ H ₃₉	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-SCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-SC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-SC ₄ H ₉	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-SC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-SC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-SC ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-SC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-SCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-SCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-SCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-SC ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-SC ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-SC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-SC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-SC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-SC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-SCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-SCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-SC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-SC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-SC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-SC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-SC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-SC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-SCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-SC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-SC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-SC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-SC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-SC ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-SC ₁₈ H ₃₉	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-CONHC ₂ H ₅	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-CONHC ₄ H ₉	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-CONHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-CONHC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -2-CONHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-CONHCH ₃	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-CONHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-CONHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-CONHC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-CONHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-CONHC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-CONHC ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-CONHCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₅ H ₁₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-CONHC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-CONHC ₁₄ H ₂₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₁₈ H ₃₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-CONHC ₁₉ H ₃₉	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Br	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-CH ₂ Br	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -2-CH ₂ Br	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -3-CH ₂ Br	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ F	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₄ Cl	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₂ CHFC ₃ H ₇	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CHBrC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Br	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -2-CF ₃	H	H	H	H

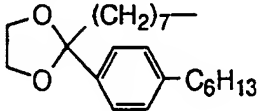
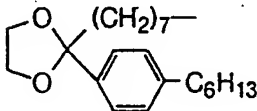
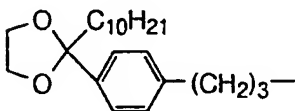
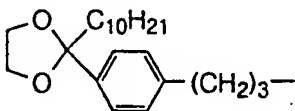
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -3-CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-CF ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Cl	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-CH ₂ Br	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ F	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CF ₂ C ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-CF ₂ C ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₄ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-CH ₂ Br	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₂ CHClC ₃ H ₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-CH ₂ Br	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-CH ₂ Br	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ CHFC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CHClC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₄ -4-(CH ₂) ₅ CHClC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₄ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -2-CH ₂ CHBrCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₃ CHFC ₄ H ₉	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-CH ₂ Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ CHClC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₁₀ Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₇ CHClC ₂ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -3-(CH ₂) ₃ CHFC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₉ CBBr ₂ C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₈ CF ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	H	H	H	H

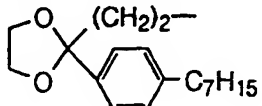
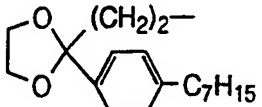
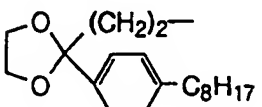
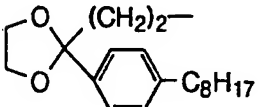
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -2-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -3-NH ₂	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -2-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH[(CH ₂) ₆ C≡CC ₂ H ₅]C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-NH ₂	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-NH ₂	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	COCH ₃	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NO ₂	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH[(CH ₂) ₆ C≡CC ₂ H ₅]C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ C≡CC ₆ H ₄ -3-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-NO ₂	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-OH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OH	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-OH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-OH	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-OH	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -2-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H

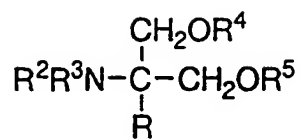
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH[(CH ₂) ₆ C≡CC ₂ H ₅]C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-OH	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)C ₆ H ₁₀ -4-OH	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-OH	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-COOH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-COOH	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-COOH	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -2-COOH	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -2-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -3-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-COOH	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH[(CH ₂) ₆ C≡CC ₂ H ₅]C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H

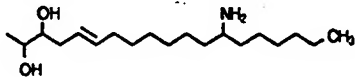
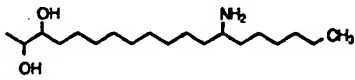
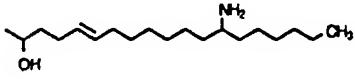
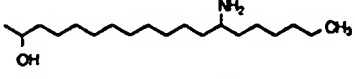
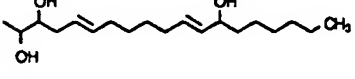
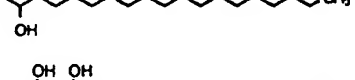

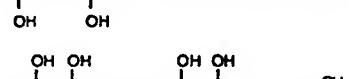
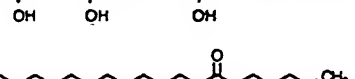


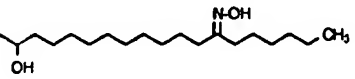
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-COOH	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)C ₆ H ₁₀ -4-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-COOH	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-Br	H	H	H	H
C ₆ H ₁₀ -4-Cl	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Br	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₁₀ -4-Cl	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Cl	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -3-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-Cl	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-Br	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-I	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -2-Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₁₀ -4-Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -2-Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-Br	H	H	H	H
CH=CHCH ₂ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ C ₆ H ₁₀ -4-Br	H	H	H	H
CH ₂ C≡C(CH ₂) ₄ C ₆ H ₁₀ -4-Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₈ H ₁₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ CH(C ₄ H ₉)C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -2-Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-Br	H	H	H	H

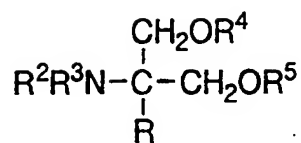
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₀ C≡CCH(CH ₃)C ₆ H ₄ -4-Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH[(CH ₂) ₆ C≡CC ₂ H ₅]C ₆ H ₄ -4-Br	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ CH(CH ₃)C ₆ H ₄ -3-Cl	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-Br	H	H	H	H
CH ₂ CH(C ₇ H ₁₅)C ₆ H ₁₀ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ CH(CH ₃)C ₆ H ₁₀ -4-Cl	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-NH ₂)-3-Cl	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-NH ₂)-2-CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₃ (-2-NHCOCH ₃)-4-OCH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ C ₆ H ₃ (-4-COOC ₂ H ₅)-3-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ C ₆ H ₂ (-4-Br)(-3-C ₂ H ₅)-2-COOH	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)C ₆ H ₂ (-3-C ₄ H ₉)(-2-F)-4-NO ₂	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₃ (-3-F)-4-C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₃ (-3-F)-4-C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₃ (-2-C ₂ H ₅)-4-C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₃ (-2-C ₂ H ₅)-4-C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₃ (-3-CH ₃)-4-C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₃ (-3-CH ₃)-4-C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-OC ₇ H ₁₅)-3-OCH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-OC ₇ H ₁₅)-3-OCH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-OC ₇ H ₁₅)-3-CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₃ (-4-OC ₇ H ₁₅)-3-CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
	H	H	H	H
	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
	H	H	H	H
	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
	H	H	H	H
	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
	H	H	H	H
	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₆ COC ₆ H ₄ -4-C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
COC ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	H	H	H	H
COC ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
COC ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
COC ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH(OH)C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	H	H	H	H
CH(OH)C ₆ H ₄ -4-C ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH(OH)C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	H	H	H	H
CH(OH)C ₆ H ₄ -4-C ₈ H ₁₇	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₁₃	COCH ₃	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₇ F	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₇ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCF ₂ C ₆ H ₁₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OCF ₂ C ₆ H ₁₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₈ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ OC ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₁ OC ₆ H ₅	COCH ₃	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ O(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ O(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ OCH ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	H	H	H	H

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ C ₆ H ₄ O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ CH ₂ O(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ CH ₂ O(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃



R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H



R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₄ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₅ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -2-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -3-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₄ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₄ CH ₃	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₉ F	H	H	H	H
C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₃ F	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O)(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-S(=O) ₂ (CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₄ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₁ F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₁₁ F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₁₀ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₅	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₅ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₄ -3-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₄ -3-F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₄ -4-F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₄ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₅ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₆ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₈ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₉ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂₀ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₈ OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ OCH ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ OC ₆ H ₅	H	H	H	H

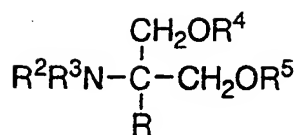
R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ OC ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₄ -4-F	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-OCH ₂ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₄ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₈ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ OC ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CHFC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CHFC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ CHFC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH(OH)CH(OH)C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH ₃	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	H	H	H	H
[CH(OH)] ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH(OH)CH ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
[CH(OH)] ₂ C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ CH(OH)C ₆ H ₄ -4-O-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
CH=CHC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ CH=CHCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ OCH ₂ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ OCH ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ O(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ O(CH ₂) ₃ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ O(CH ₂) ₅ C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₄ -4-CH ₂ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ O(CH ₂) ₇ C ₆ H ₄ -4-CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ O(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ O(CH ₂) ₁₁ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₆ C ₆ H ₄ -4-F	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	H	H	H	H
CH ₂ OC ₆ H ₄ -4-O(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-OCH ₃)-4-OC ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-OCH ₃)-4-OC ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-F)-4-O(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-F)-4-O(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-F)-4-O(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (3-F)-4-O(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-O(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-O(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-O(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₃ (2-F)-4-O(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-N(CH ₃)C ₇ H ₁₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-N(CH ₃)C ₇ H ₁₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-N(CH ₃)C ₁₁ H ₂₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-N(CH ₃)C ₁₁ H ₂₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₆ H ₁₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₆ H ₁₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₁₀ H ₂₁	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ C ₆ H ₄ -4-NHCOC ₁₀ H ₂₁	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃



R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₅ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₅ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₄ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₈ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -2-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -2-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₄ H ₂ S-4-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₄ H ₂ S-4-CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₁ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₄ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₅ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₅ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₆ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₈ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₈ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H

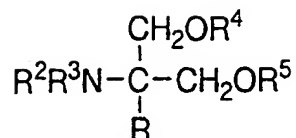
R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -2-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -2-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -3-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₃ S	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH ₃	H	H	H
CH ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₄ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₅ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₂ S-5-CH ₂ CH ₃	COCH ₃	H	H	H
(CH ₂) ₇ -2-C ₄ H ₂ S-5-CH ₂ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₈ -2-C ₄ H ₂ S-5-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ -2-C ₄ H ₂ S-5-CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₅ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₆ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₈ -3-C ₄ H ₃ S	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	H	H	H
CH ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₄ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₅ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₅ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₄ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₉ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ CH ₃	COCH ₃	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₁ -3-C ₄ H ₂ S-4-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ -3-C ₄ H ₂ S-4-CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-4-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₃ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₅ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₅ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₈ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -3-C ₄ H ₂ S-5-CH ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -3-C ₄ H ₂ S-5-CH ₂ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₂ S-5-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₄ H ₂ S-5-CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-CH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₆ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₇ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₈ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₉ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₄ H ₂ S-5-(CH ₂) ₁₀ C ₆ H ₅	COCH ₃	H	COCH ₃	COCH ₃



R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₃ N-4-CH ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₃ N-4-CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
CH ₂ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₁ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₂ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₃ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₄ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₅ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₅ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₆ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₆ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₇ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₈ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-4-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -4-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -4-C ₅ H ₃ N-2-CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
CH ₂ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₁ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₉ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₀ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₂ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₃ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₄ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₅ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₅ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₆ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₆ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₇ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -4-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -4-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₃ N-5-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO

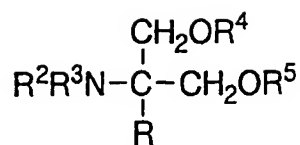
R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -5-C ₅ H ₃ N-25-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ -5-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -5-C ₅ H ₃ N-2-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO

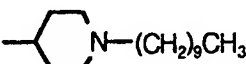
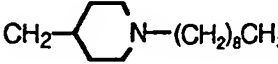
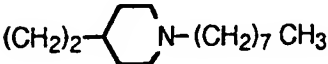
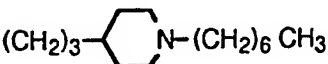
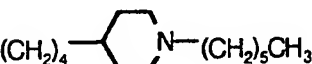
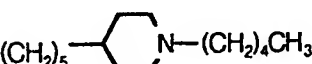
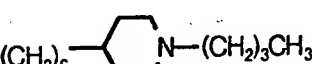
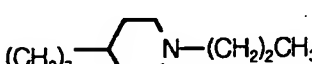
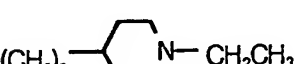
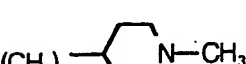
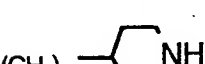
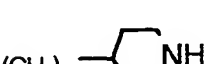
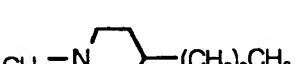
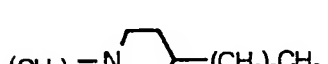

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -5-C ₅ H ₃ N-2-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -2-C ₅ H ₃ N-6-CH ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -2-C ₅ H ₃ N-6-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₈ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -2-C ₅ H ₃ N-6-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₀ CH ₃	H	H	H	H
CH ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₃ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₄ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₅ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₆ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₇ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₈ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -3-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₅ H ₃ N-5-CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₉ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₉ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₂ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₂ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO

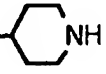
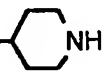
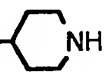
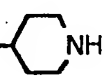
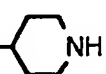
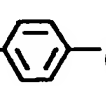
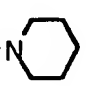
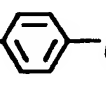
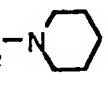
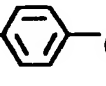
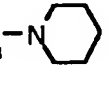
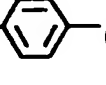
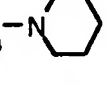
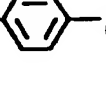
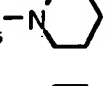
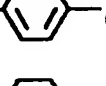
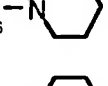



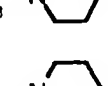

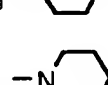
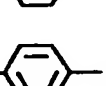
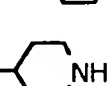
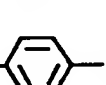
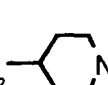
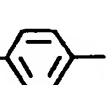
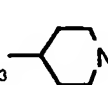


R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₃ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₃ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₄ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₅ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₅ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₆ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₆ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₁₇ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₇ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₂ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₄ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₅ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₆ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₇ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₈ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO





































R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₉ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₃ N-5-(CH ₂) ₁₀ -C ₆ H ₅	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-CH ₂ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₂ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₃ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₄ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₅ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₆ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₇ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₈ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₉ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -(CH ₂) ₉ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -3-C ₅ H ₄ N	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -4-(CH ₂) ₁₀ -3-C ₅ H ₄ N	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO



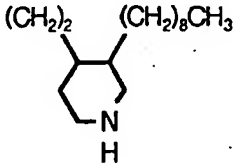

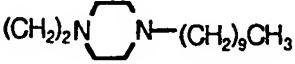
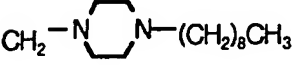
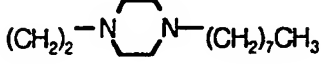
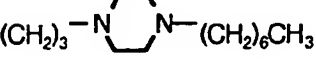
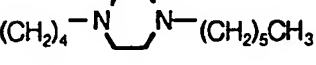
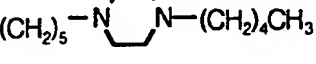
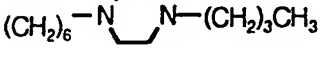
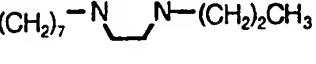
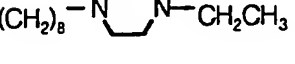
R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_4\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle\text{-(CH}_2)_5\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_5\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle\text{-(CH}_2)_4\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_6\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle\text{-(CH}_2)_3\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_7\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle\text{-(CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_8\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle\text{-CH}_2\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_9\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle\text{-CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{10}\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle\text{-(CH}_2)_8\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle\text{-(CH}_2)_9\text{CH}_3$	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
$(\text{CH}_2)_2\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle\text{-(CH}_2)_{10}\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle\text{-(CH}_2)_{11}\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{11}\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{12}\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle$	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
$(\text{CH}_2)_{13}\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{14}\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{15}\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{16}\text{-N}\langle\text{C}_6\text{H}_{10}\rangle$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{11}\text{-}\langle\text{C}_6\text{H}_9\rangle\text{NH}$	H	H	H	H























R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_{12}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{13}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{14}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{15}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{16}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -CH ₂ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₂ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₃ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₄ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₅ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₆ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₇ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₈ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₉ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₁₀ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -CH ₂ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₂ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₃ - 	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_4$ -  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ -  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_6$ -  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_7$ -  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_8$ -  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ -  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_{10}$ -  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N-CH ₂ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N-(CH ₂) ₂ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N-(CH ₂) ₃ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N-(CH ₂) ₄ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N-(CH ₂) ₅ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N-(CH ₂) ₆ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N-(CH ₂) ₇ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N-(CH ₂) ₈ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N-(CH ₂) ₉ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N-(CH ₂) ₁₀ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -N  -CH ₂ - 	H	H	H	H

















R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H

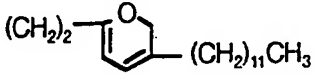

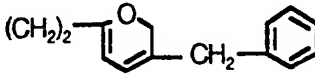
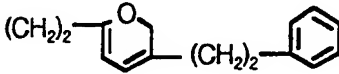
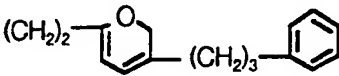
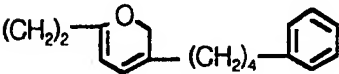
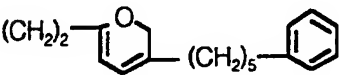
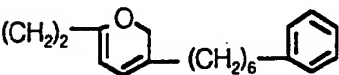
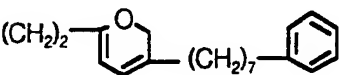
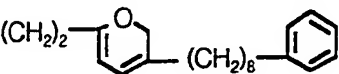
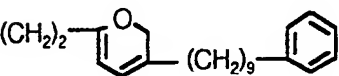
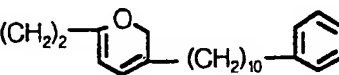
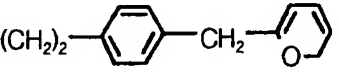
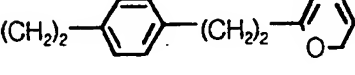
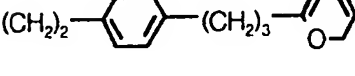
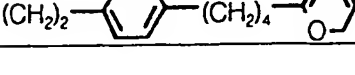
R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H

















R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_9-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{N}-\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{10}-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{NH} \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{N}-(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{N}-(\text{CH}_2)_3-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{N}-(\text{CH}_2)_4-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{N}-(\text{CH}_2)_5-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{N}-(\text{CH}_2)_6-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{N}-(\text{CH}_2)_7-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{N}-(\text{CH}_2)_8-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{N}-(\text{CH}_2)_9-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{N}-(\text{CH}_2)_{10}-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{NH} \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{NH} \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_3-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{NH} \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_4-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{NH} \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_5-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{NH} \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_6-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \quad \\ \text{NH} \end{array}$	H	H	H	H

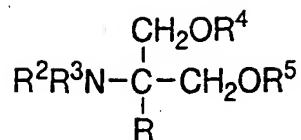
R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_7$ -N  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_8$ -N  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ -N  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_{10}$ -N  NH	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -N  N- $(\text{CH}_2)_{11}\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N- $(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N- $(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$	H	H	H	H
CH_2 -  N- $(\text{CH}_2)_9\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  N- $(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_3$ -  N- $(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_4$ -  N- $(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_5$ -  N- $(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_6$ -  N- $(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_7$ -  N- $(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_8$ -  N- $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_9$ -  N- CH_2CH_3	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{10}$ -  N- CH_3	H	H	H	H
CH_2 -N  - $(\text{CH}_2)_9\text{CH}_3$	H	H	H	H



















R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_3-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_4-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_5-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_6-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_7-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_8-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_9-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{CH}_2\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{10}-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} (\text{CH}_2)_{12}\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CH}_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_3-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_4-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_5-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_6-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_7-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-(\text{CH}_2)_8-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array}$	H	H	H	H

























R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ -N 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_{10}$ -N 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -N  - $(\text{CH}_2)_{12}\text{CH}_3$	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
$(\text{CH}_2)_2$ -  N- $(\text{CH}_2)_{12}\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_3$ -  - $(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_4$ -  - $(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_5$ -  - $(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_6$ -  - $(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_7$ -  - $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_8$ -  - CH_2CH_3	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_9$ -  - CH_3	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO












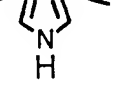

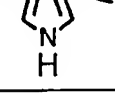

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H



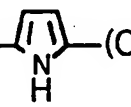

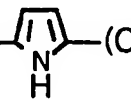

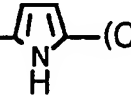

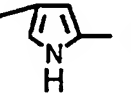



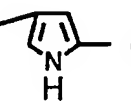

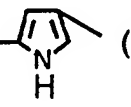

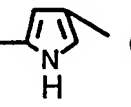

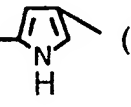

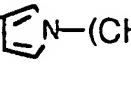

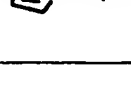

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_6$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_7$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_8$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_{10}$ - 	CH ₃ CO	H	CH ₃ CO	CH ₃ CO
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_{11}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$	H	H	H	H



























R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₀ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₅ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₄ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₅ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₈ - 	H	H	H	H






























R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_4$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_8$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_6$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_{10}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{10}$ - 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{10}$ - 	Ac	H	Ac	Ac
$(\text{CH}_2)_{11}$ - 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{11}$ - 	Ac	H	Ac	Ac
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$	Ac	H	Ac	Ac

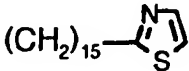
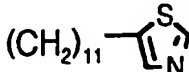
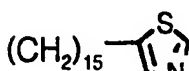
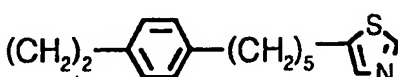
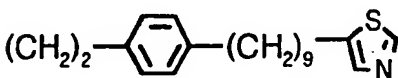
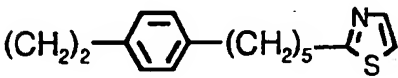
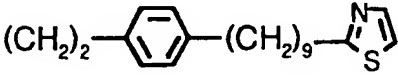
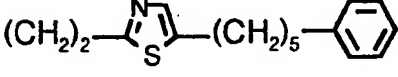
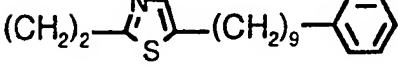
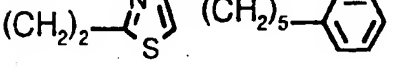
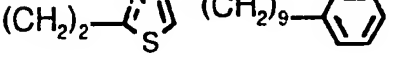
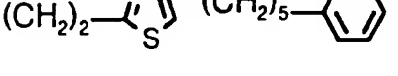
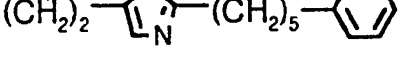
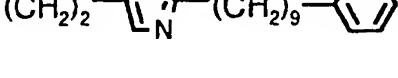
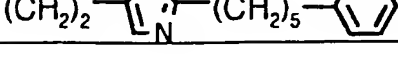
R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
(CH ₂) ₁₀ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ - 	Ac	H	H	H
(CH ₂) ₁₀ - 	Ac	H	Ac	Ac
(CH ₂) ₁₄ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ - 	Ac	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ - 	Ac	H	Ac	Ac
(CH ₂) ₁₅ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ -N 	H	H	H	H
(CH ₂) ₁₁ -N 	Ac	H	H	H
(CH ₂) ₁₄ -N 	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₆ - 	H	H	H	H
(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₆ - 	Ac	H	H	H





















R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_{10}$ 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_4$ 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_4$ 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_8$ 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_5$ 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_5$ 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_9$ 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_5$ 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_5$ 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_9$ 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_5$ 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$  $(\text{CH}_2)_5$ 	Ac	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	Ac	H	H	H
	H	H	H	H
	Ac	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	Ac	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	Ac	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{11}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{15}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{11}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{15}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{11}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{15}$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_9$ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  - $(\text{CH}_2)_5$ - 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_{11}$ - 	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	Ac	H	H	H
	H	H	H	H
	H	H	H	H
	Ac	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₅ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₉ - 	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₅ - 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₉ - 	Ac	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₉ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₁₃ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₈ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₁₂ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₇ CH ₃	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2$ -  -(CH ₂) ₁₁ CH ₃	H	H	H	H

R	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}-(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}-(\text{CH}_2)_{11}\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}-(\text{CH}_2)_{10}\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}-(\text{CH}_2)_{10}\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}-(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}-(\text{CH}_2)_{11}\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_2-(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_2-(\text{CH}_2)_{11}\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_2-(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$	H	H	H	H
$(\text{CH}_2)_2-\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_2-(\text{CH}_2)_{10}\text{CH}_3$	H	H	H	H

一般式 (I) の化合物 (以下、化合物 (I) という) の製薬上許容される塩としては、塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩等の無機酸との塩、または酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、安息香酸塩、クエン酸塩、リンゴ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩等の有機酸との塩、あるいはカルボキシル基を含む場合は、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、アルミニウム塩等の金属塩、トリエチルアミン等のアミンとの塩またはリジン等の二塩基性アミノ酸との塩があげられる。また、本発明化合物は水和物、溶媒和物等も包含される。

本発明化合物に幾何異性体が存在する場合、本発明はシス体、トランス体さらにはそれらの混合物をも包含するものである。さらに、本発明化合物にその分子内に1個またはそれ以上の不斉中心が存在する場合、それにより各種の光学異性体が存在する。本発明は光学異性体、ラセミ体さらにはジアステレオ異性体、およびそれらの混合物をも包含するものである。

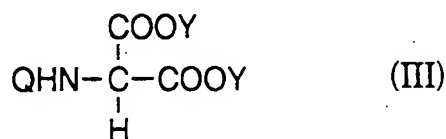
本発明化合物は以下の方法により製造することができる。

(A法)

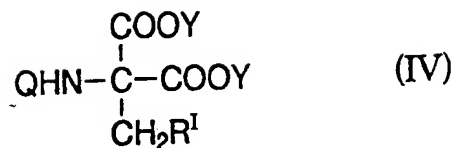
一般式 (II)



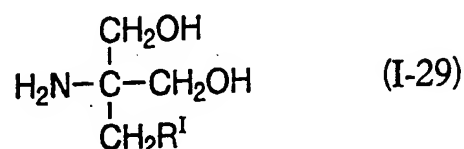
〔式中、 $R'CH_2$ はRに包含される前記の $R'CH_2$, $R'aCH_2$, $R'bCH_2$, Ra , Rb , Rc , Rd , Re , Rf , Rg , Rh , Ri , Rj , Rk , RI , Rm , Rn または Ro と同義である。Gは有機合成化学の分野で広く用いられる脱離基、例えばハロゲン（フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）、メタンスルホニルオキシ、p-トルエンスルホニルオキシ、トリフルオロメタンスルホニルオキシを示す。〕で表される化合物〔以下、化合物 (II) という〕、または R' が官能基（アミノ、水酸基、メルカプト、ケトン、カルボキシ等）を有する場合にはそれらを必要に応じて保護した化合物〔以下、化合物 B - (II) という〕に、一般式 (III)



〔式中、Yは低級アルキル（メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、第3級ブチル等）またはアラルキル（ベンジル、ニトロベンジル、メトキシベンジル、メチルベンジル等）を示し、Qは有機合成化学の分野で広く用いられるアミノの保護基、例えばアセチル、ベンゾイル、第3級ブトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニルを示す。さらに式中、分子内の2つのYは同一となってジオキサン等の環を形成してもよい。また、分子内のQとYは同一となってオキサゾリジンやオキサジン等の環を形成してもよい。〕で表される化合物〔以下、化合物 (III) という〕を塩基の存在下縮合し、一般式 (IV)



(式中、 R^1 、 Q 、 Y は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物 (IV) という〕とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより、一般式 (I-29)



(式中、 R^1 は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物 (I-29) という〕またはその N -および/または O -保護体を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラゼン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常 30 分間から 2 日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (IV) を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第 3 級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

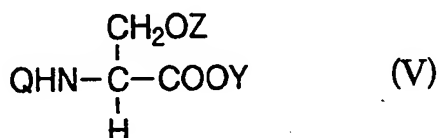
カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボキシの還元反応の反応時間は、通常 30 分間から 10 時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することができる。

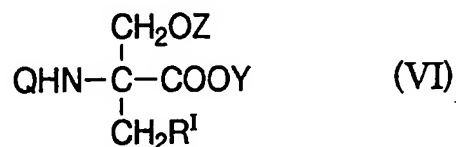
(B 法)

化合物 (II) または化合物 B - (II) に、一般式 (V)



(式中、Y、Q は前記と同義である。Z は有機合成化学の分野で広く用いられる

水酸基の保護基、例えばアセチル、ベンゾイル、ベンジル、トリメチルシリル、第3級ブチルジメチルシリル、メトキシメチル、メトキシエトキシメチル、テトラヒドロピラニルを示す。)で表される化合物〔以下、化合物(V)という〕を塩基の存在下縮合し、一般式(VI)



(式中、 R^1 、Q、Y、Zは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(VI)という〕とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより化合物(I-29)またはそのN-および/またはO-保護体を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去し

た後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(VI)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

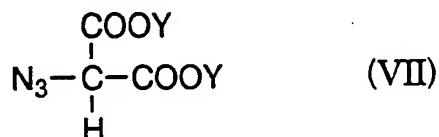
カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

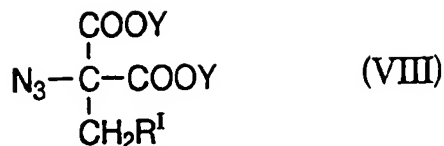
上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することができる。

(C法)

化合物(II)または化合物B-(II)に、一般式(VII)



(式中、Yは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(VII)という〕を塩基の存在下縮合し、一般式(VIII)



(式中、 R^1 、 Y は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(VI II)という〕とした後、カルボキシおよびアジドを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより化合物(1-29)またはそのO-保護体を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(VIII)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナト

リウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

アジドの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属（パラジウム-炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等）を用いた接触還元があげられる。

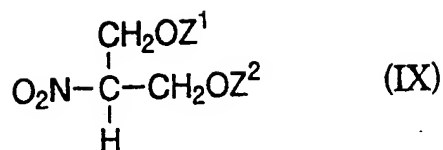
アジドの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

アジドの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

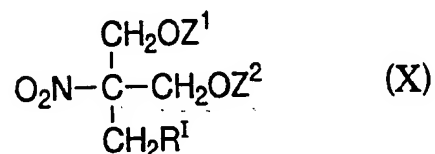
上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することができる。

(D法)

化合物(II)または化合物B-(II)に、一般式(IX)



(式中、 Z^1 、 Z^2 は同一または異なって有機合成化学の分野で広く用いられる水酸基の保護基、例えばアセチル、ベンゾイル、ベンジル、トリメチルシリル、第3級ブチルジメチルシリル、メトキシメチル、メトキシエトキシメチル、テトラヒドロピラニルを示す。さらに Z^1 、 Z^2 は同一となってジオキサン等の環を形成していてもよい。) で表される化合物〔以下、化合物 (IX) という〕を塩基の存在下縮合し、一般式 (X)



(式中、 R^1 、 Z^1 、 Z^2 は前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (X) という〕とした後、ニトロを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより化合物 (I-29) またはそのO-保護体を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベン

ゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(X)を精製することができる。

ニトロの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属（パラジウム-炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等）を用いた接触還元、金属（鉄、亜鉛、スズ等）による還元があげられる。

ニトロの還元反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

ニトロの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することができる。

上記A法～D法は、一般式(I-1)～(I-18)の化合物の合成に適用することができる。

(E法)

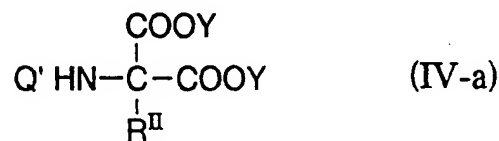
一般式(XI)



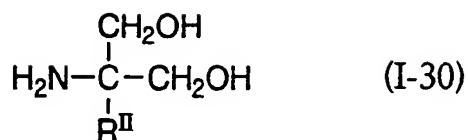
〔式中、 R^{11} はR中、前記の $CH_2 R^1$, $CH_2 R^{1a}$, $CH_2 R^{1b}$, R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , R^f , R^g , R^h , R^i , R^j , R^k , R^l , R^m , R^n , R^o , R^p , R^q , $CH=CHR^t$, $CH=CHR^u$, $(CH_2)_\alpha - X - (CH_2)_\beta R^v$ (ただし、 $\alpha \geq 1$ の場合) または $CH_2 OR^w$ と同義である。Mは有機合成化学の分野で広く用いられる金属、例えばリチウム、マグネシウムクロリド、マグネシウムブロミド、マグネシウムヨード、銅、リチウム銅、ニッケルを示し、nは1～3の整数を示す。〕で表される化合物〔以下、化合物(XI)という〕、または R^{11} が官能基(アミノ、水酸基、メルカプト、ケトン、カルボキシ等)を有する場合にはそれらを必要に応じて保護した化合物〔以下、化合物B-(XI)という〕を、一般式(XII)



〔式中、Yは前記と同義である。 Q' は有機合成化学の分野で広く用いられるイミノの保護基、例えばアセチル、ベンゾイル、第3級ブトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニルを示す。〕で表される化合物〔以下、化合物(XII)という〕に求核付加させ、一般式(IV-a)



〔式中、 R^{11} 、 Q' 、Yは前記と同義である。〕で表される化合物(IV-a)とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより一般式(I-30)



(式中、 R^{II} は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(I-30)という)またはそのN-および/またはO-保護体を製造することができる。

付加反応に用いられる有機溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

付加反応の反応温度は、通常 $-100 \sim 80^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

付加反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により付加反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(IV-a)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

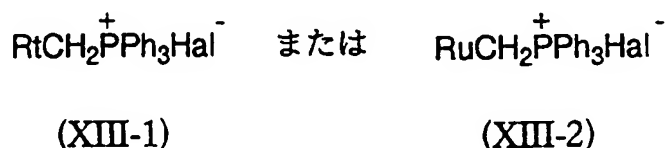
カルボキシの還元反応の反応時間は、通常 30 分間から 10 時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することができる。

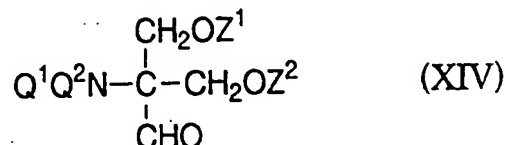
本方法は、一般式 (I-1) ~ (I-20)、(I-24)、(I-25)、(I-26) (ただし、 $\alpha \geq 1$ の場合)、(I-27) の化合物の合成に適用することができる。

(F 法)

一般式 (XIII)

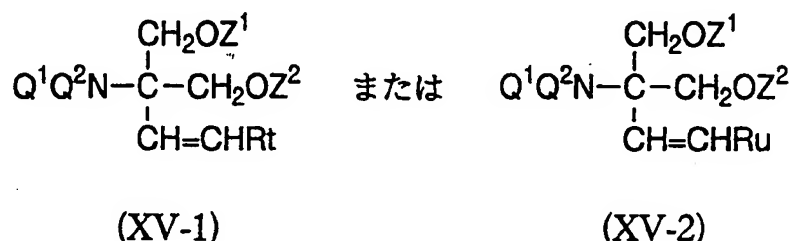


(式中、Hal は塩素、臭素、ヨウ素などのハロゲンを示し、Rt、Ru は前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XIII-1) または化合物 (XIII-2) という〕、または Rt、Ru が官能基 (アミノ、水酸基、メルカプト、ケトン、カルボキシ等) を有する場合にはそれらを必要に応じて保護した化合物〔以下、化合物 B - (XIII-1) または化合物 B - (XIII-2) という〕を、一般式 (XIV)



(式中、 Q^1 、 Q^2 は有機合成化学の分野で広く用いられるアミノの保護基、例

例えばアセチル、ベンゾイル、第3級ブトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、ベンジルを示し、どちらか一方は水素であってもよい。 Z^1 、 Z^2 は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XIV)という〕と塩基の存在下縮合させ、一般式(XV)



(式中、 Rt 、 Ru 、 Q^1 、 Q^2 、 Z^1 、 Z^2 は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XV-1)または化合物(XV-2)という〕とした後、さらに必要に応じて保護基を除去することにより化合物(I-24)または(I-25)を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じ

てこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XV-1)または化合物(XV-2)を精製することができる。

このように本方法は、一般式(I-24)または(I-25)の化合物の合成に適用することができる。さらに、一般式(I-24)または(I-25)の化合物またはそのN-および/またはO-保護体の二重結合を還元することにより一般式(I-1)～(I-18)、(I-26)(ただし、 $\alpha \geq 2$ の場合)の化合物の合成に適用することもできる。

二重結合の還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウム-炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元があげられる。

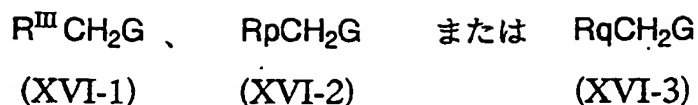
二重結合の還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

二重結合の還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

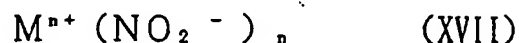
上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物〔一般式(I-1)～(I-18)、(I-26)(ただし、 $\alpha \geq 2$ の場合)の化合物〕を精製することができる。

(G法)

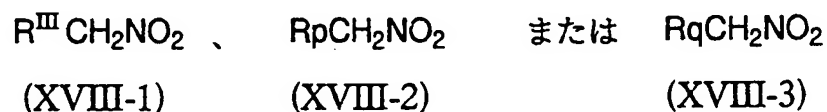
一般式(XVI)



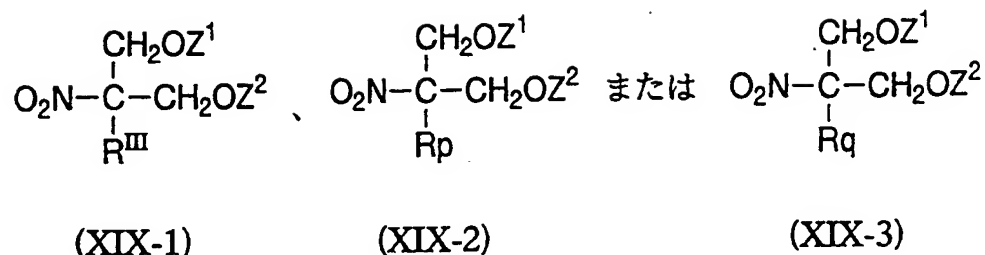
(式中、 R^{III} はR中、前記の $\text{CH}_2 R^{\text{I}}$, $\text{CH}_2 R^{\text{Ia}}$, $\text{CH}_2 R^{\text{Ib}}$, R_a , R_b , R_c , R_d , R_e , R_f , R_g , R_h , R_i , R_j , R_k , R_l , R_m , R_n , R_o を示し、 R_p 、 R_q 、 G は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XVI-1)、化合物(XVI-2)または化合物(XVI-3)という〕、または R^{III} 、 R_p 、 R_q が官能基(アミノ、水酸基、メルカプト、ケトン、カルボキシ等)を有する場合にはそれらを必要に応じて保護した化合物〔以下、化合物B-(XVI-1)、化合物B-(XVI-2)または化合物B-(XVI-3)という〕を、一般式(XVII)



(式中、 M は金属、例えばナトリウム、カリウム、マグネシウム、銀、カルシウム、リチウムを示し、 n は1または2の整数を示す。)で表される化合物〔以下、化合物(XVII)という〕を作用させることにより、一般式(XVIII)



(式中、 R^{III} 、 R_p 、 R_q は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XVIII-1)、化合物(XVIII-2)または化合物(XVIII-3)という〕とした後、これを塩基の存在下ホルマリンと縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式(XIX)



(式中、 R^{III} 、 R_p 、 R_q 、 Z^1 、 Z^2 は前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XIX-1)、化合物(XIX-2)または化合物(XIX-3)という)とした後、ニトロを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより、化合物(I-19)、(I-20)を含む目的物を製造することができる。

亜硝酸塩(XVII)と化合物(XVI-1)、化合物(XVI-2)または化合物(XVI-3)との縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XVIII-1)、化合物(XVIII-2)または化合物(XVIII-3)を精製することができる。

化合物(XVIII-1)、化合物(XVIII-2)または化合物(XVIII-3)とホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリ

、コールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20～150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XIX-1)、化合物(XIX-2)または化合物(XIX-3)を精製することができる。

ニトロの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウム-炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元、金属(鉄、亜鉛、スズ等)による還元があげられる。

ニトロの還元反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

ニトロの還元反応の反応温度は、通常-20～80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

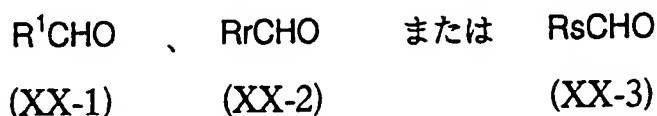
上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により目的物を精製することがで

きる。

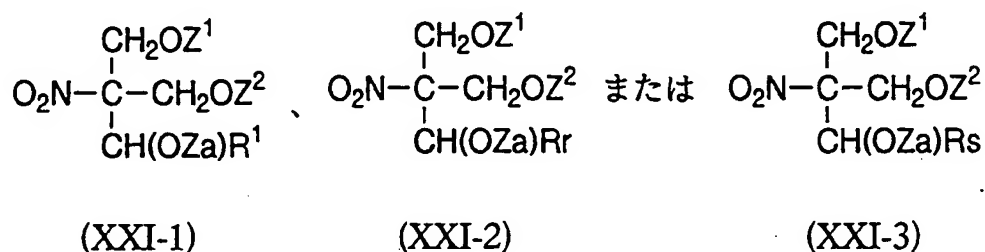
本方法は化合物 (I-19) および (I-20) の合成に適しているが、一般式 (I-1) ~ (I-18) の化合物の合成にも適用することができる。

(H法)

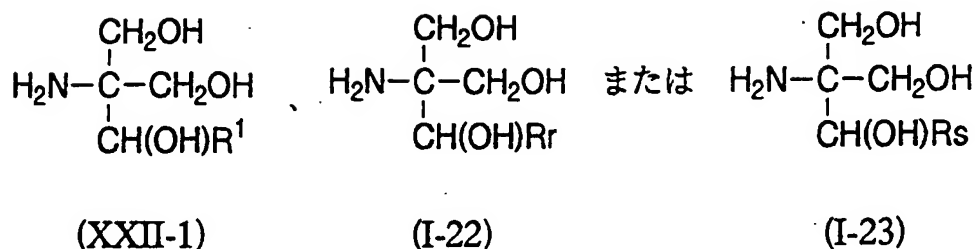
一般式 (XX)



(式中、 R^1 、 Rr 、 Rs は前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XX-1)、化合物 (XX-2) または化合物 (XX-3) という〕と化合物 (IX) を塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護し、一般式 (XXI)



(式中、 R^1 、 Rr 、 Rs 、 Z^1 、 Z^2 は前記と同義であり、 Za は水素または有機合成化学の分野で広く用いられる水酸基の保護基、例えばアセチル、ベンゾイル、ベンジル、トリメチルシリル、第3級ブチルジメチルシリル、メトキシメチル、メトキシエトキシメチル、テトラヒドロピラニルを示す。) で表される化合物〔以下、化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2) または化合物 (XXI-3) という〕とした後、ニトロを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより、一般式 (XXII)



(式中、 R^1 、 Rr 、 Rs は前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XXII-1)、化合物 (I-22) または化合物 (I-23) という〕を製造することができる。

アルデヒドとの縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2) または化合物 (XXI-3) を精製することができる。

ニトロの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウ

ム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属（パラジウム-炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等）を用いた接触還元、金属（鉄、亜鉛、スズ等）による還元があげられる。

ニトロの還元反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

ニトロの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物（XXII-1）、化合物（I-22）または化合物（I-23）を精製することができる。

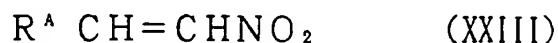
このように本方法は、一般式（I-21）～（I-23）の化合物の合成に適用することができる。

（I法）化合物（XVIII-1）は次の方法でも製造することができる。

一般式（XX'）



（式中、 R^{A} は R^{III} における炭素数が1個少ない置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖を示す。）で表される化合物〔以下、化合物（XX'）という〕とニトロメタンを塩基の存在下縮合して、一般式（XXIII）



（式中、 R^{A} は前記と同義である。）で表される化合物〔以下、化合物（XXIII）という〕とした後、二重結合を適当な還元剤で還元することにより化合物（XVII

I-1)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20～150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXIII)を精製することができる。

二重結合の還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウム-炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元があげられる。

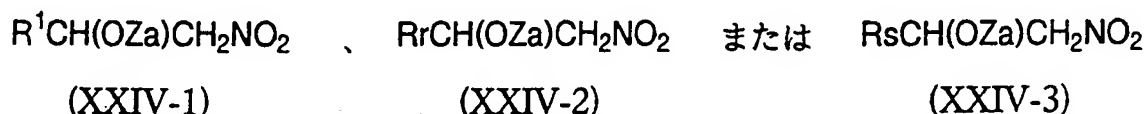
二重結合の還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

二重結合の還元反応の反応温度は、通常-20～80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

、上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XVIII-1) を精製することができる。

(J法) 化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2) または化合物 (XXI-3) は次の方法でも製造することができる。

ニトロメタンと化合物 (XX-1)、化合物 (XX-2) または化合物 (XX-3) を塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式 (XXIV)



(式中、 R^1 、 Rr 、 Rs 、 Za は前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XXIV-1)、化合物 (XXIV-2) または化合物 (XXIV-3) という〕とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2) または化合物 (XXI-3) を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上

またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常 30 分間から 2 日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXIV-1)、化合物 (XXIV-2) または化合物 (XXIV-3) を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第 3 級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 -20 ~ 150 °C であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常 30 分間から 2 日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

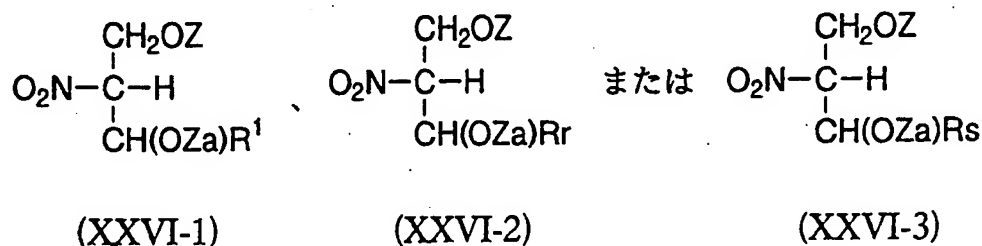
上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2) または化合物 (XXI-3) を精製することができる。

(K 法) 化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2) または化合物 (XXI-3) は次の方法でも製造することができる。

化合物 (XXV)



(式中、Zは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXV)という〕と化合物(XX-1)、化合物(XX-2)または化合物(XX-3)を塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式(XXVI)



(式中、R¹、Rr、Rs、Z、Zaは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXVI-1)、化合物(XXVI-2)または化合物(XXVI-3)という〕とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、化合物(XXI-1)、化合物(XXI-2)または化合物(XXI-3)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じ

てこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXVI-1)、化合物 (XXVI-2) または化合物 (XXVI-3) を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデカー-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

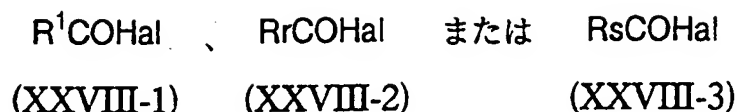
上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXI-1)、化合物 (XXI-2) または化合物 (XXI-3) を精製することができる。

(L法) 一般式 (XXVII)

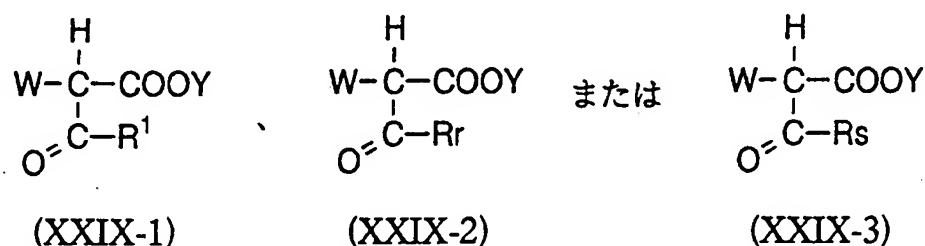


(式中、Wはアジド、ニトロあるいは適当な保護基で保護されたアミノを示し、Yは前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XXVII) という〕と

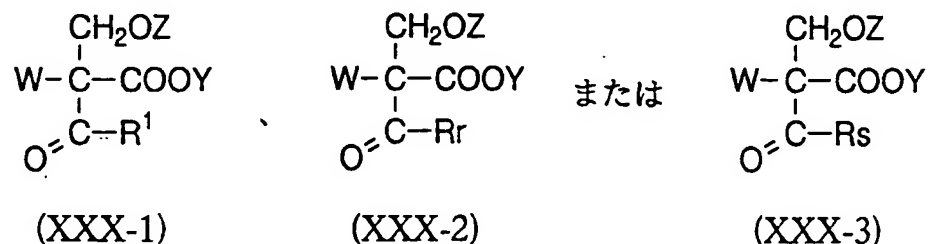
一般式 (XXVIII)



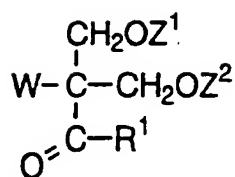
(式中、 R^1 、 Rr 、 Rs 、 Hal は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物 (XXVIII-1)、化合物 (XXVIII-2) または化合物 (XXVIII-3) という〕を塩基の存在下縮合し、一般式 (XXIX)



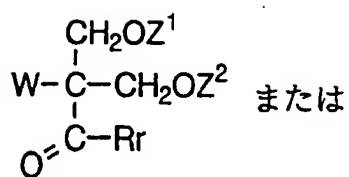
(式中、 R^1 、 Rr 、 Rs 、 W 、 Y は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物 (XXIX-1)、化合物 (XXIX-2) または化合物 (XXIX-3) という〕とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより一般式 (XXX)



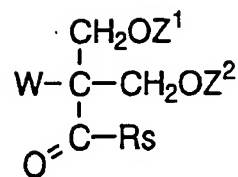
(式中、 R^1 、 Rr 、 Rs 、 W 、 Y 、 Z は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物 (XXX-1)、化合物 (XXX-2) または化合物 (XXX-3) という〕とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式 (XXXI)



(XXXI-1)



(XXXI-2)



(XXXI-3)

(式中、 R^1 、 Rr 、 Rs 、 W 、 Z^1 、 Z^2 は前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XXXI-1)、化合物 (XXXI-2) または化合物 (XXXI-3) という〕とした後、カルボニルを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて還元、脱保護することにより化合物 (XXII-1)、化合物 (I-22) または化合物 (I-23) を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXIX-1)、化合物 (XXIX-2) または化合物 (XXIX-3) を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXX-1)、化合物(XXX-2)または化合物(XXX-3)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常-20~80℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去し

た後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXI-1)、化合物 (XXXI-2) または化合物 (XXXI-3) を精製することができる。

カルボニルの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボニルの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボニルの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

カルボニルの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

さらに(i) W=アジドを有する場合、アジドの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウム-炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元があげられる。

アジドの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

アジドの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

(ii) W=ニトロを有する場合、ニトロの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、遷移金属(パラジウム-炭素、酸化白金、ラネーニッケル、ロジウム、ルテニウム等)を用いた接触還元、金属(鉄、亜鉛、スズ等)による還元があげられる。

ニトロの還元反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、アセトン、酢酸エチル、酢酸、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドがあげられる。

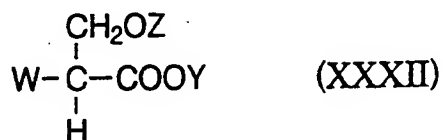
ニトロの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXII-1)、化合物(I-22)または化合物(I-23)を精製することができる。

このように本方法は、一般式(I-21)～(I-23)の化合物の合成に適用することができる。

(M法) 化合物(XXX-1)、化合物(XXX-2)または化合物(XXX-3)は次の方法でも製造することができる。

化合物(XXVIII)と一般式(XXXII)



(式中、W、Y、Zは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXII)という〕を塩基の存在下縮合することにより、化合物(XXX-1)、化合物(XXX-2)または化合物(XXX-3)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセドニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20～150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

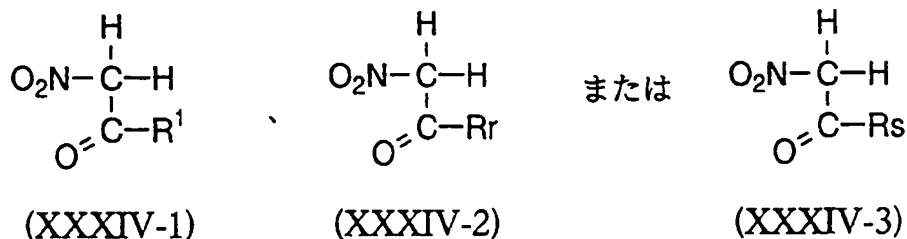
上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXX-1)、化合物(XXX-2)または化合物(XXX-3)を精製することができる。

(N法) W=ニトロの場合、化合物(XXXI-1)、化合物(XXXI-2)または化合物(XXXI-3)は次の方法でも製造することができる。

化合物(XXVIII-1)、化合物(XXVIII-2)または化合物(XXVIII-3)と化合物(XXXIII)



で表される化合物〔以下、化合物(XXXIII)という〕を塩基の存在下縮合し、一般式(XXXIV)



(式中、R¹、Rr、Rsは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化

合物 (XXXIV-1)、化合物 (XXXIV-2) または化合物 (XXXIV-3) という) として後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより化合物 (XXXI-1)、化合物 (XXXI-2) または化合物 (XXXI-3) を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXIV-1)、化合物 (XXXIV-2) または化合物 (XXXIV-3) を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエ

チルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

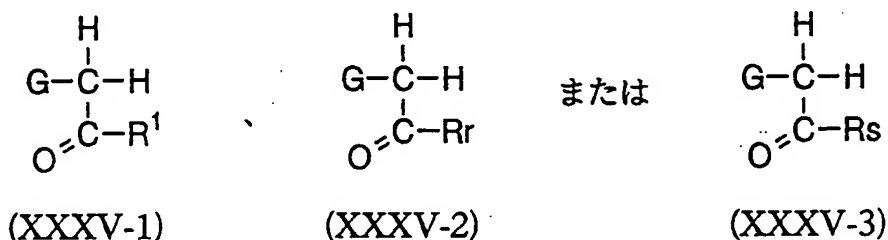
縮合反応の反応温度は、通常-20～150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXI-1)、化合物(XXXI-2)または化合物(XXXI-3)を精製することができる。

(O法) 化合物(XXXIV-1)、化合物(XXXIV-2)または化合物(XXXIV-3)は次の方法でも製造することができる。

化合物(XVII)と一般式(XXXV)



(式中、R¹、Rr、Rs、Gは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXV-1)、化合物(XXXV-2)または化合物(XXXV-3)という〕を塩基の存在下縮合することにより、化合物(XXXIV-1)、化合物(XXXIV-2)または化合物(XXXIV-3)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー-7-エンがあげられる。

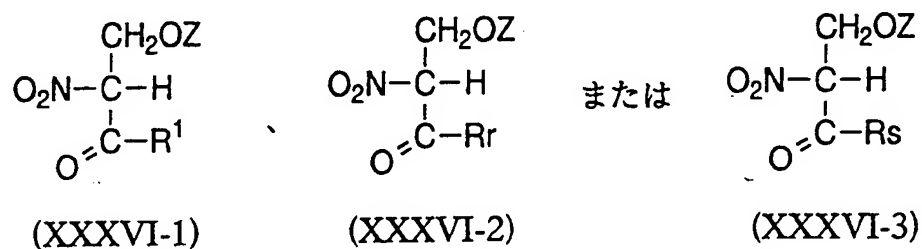
縮合反応の反応温度は、通常-20～150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXIV-1)、化合物(XXXIV-2)または化合物(XXXIV-3)を精製することができる。

(P法) W=ニトロの場合、化合物(XXXI-1)、化合物(XXXI-2)または化合物(XXXI-3)は次の方法でも製造することができる。

化合物(XXV)と化合物(XXVIII-1)、化合物(XXVIII-2)または化合物(XXVIII-3)を塩基の存在下縮合することにより、一般式(XXXVI)



(式中、R¹、Rr、Rs、Zは前記と同義である。)で表される化合物(以下、化合物(XXXVI-1)、化合物(XXXVI-2)または化合物(XXXVI-3)という)とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、化合物(XXXI-1)、化合物(XXXI-2)または化合物(XXXI-3)を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第

3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20～150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXVI-1)、化合物(XXXVI-2)または化合物(XXXVI-3)を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20～150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

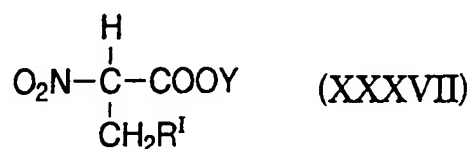
縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じ

てこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

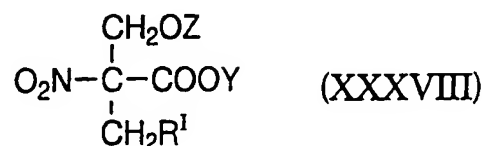
上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXI-1)、化合物 (XXXI-2) または化合物 (XXXI-3) を精製することができる。

(Q法) 化合物 (X) は次の方法でも製造することができる。

化合物 (II) と化合物 (XXVII) (W=ニトロの場合) を塩基の存在下縮合することにより、一般式 (XXXVII)



(式中、R^I、Yは前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XXVII) という〕とした後、ホルマリンと塩基の存在下縮合し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式 (XXXVIII)



(式中、R^I、Y、Zは前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XXXVIII) という〕とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、化合物 (X) を製造することができる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロ

ロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20～150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXVII)を精製することができる。

ホルマリンとの縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20～150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロ

マトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXVIII) を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

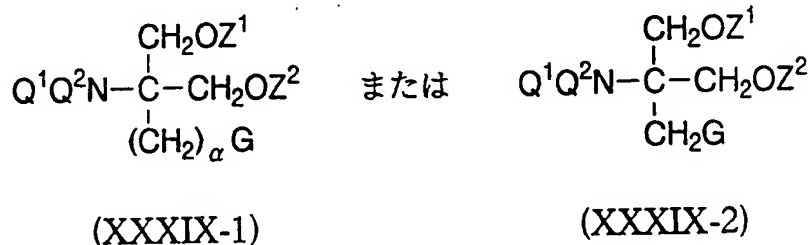
カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

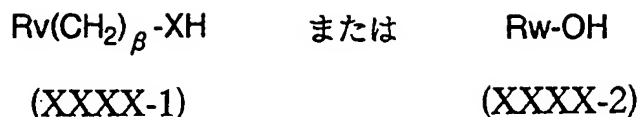
カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (X) を精製することができる。

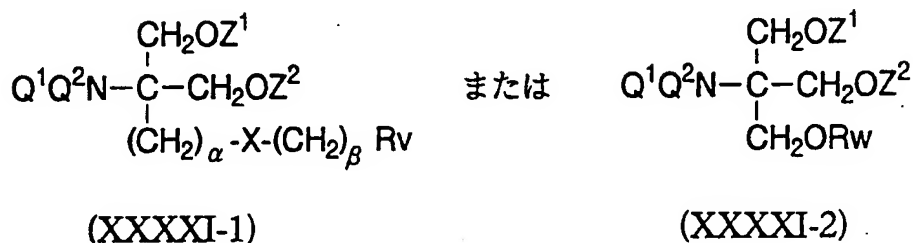
(R法) 一般式 (XXXIX)



(式中、 Q^1 、 Q^2 、 Z^1 、 Z^2 、 G 、 α は前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XXXIX-1) または化合物 (XXXIX-2) という〕と一般式 (XXXX)



(式中、Rv、Rw、X、 β は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXX-1)または化合物(XXXX-2)という〕を塩基の存在下縮合させ、一般式(XXXXI)



(式中、Rv、Rw、X、 Q^1 、 Q^2 、 Z^1 、 Z^2 、 α 、 β は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXXI-1)または化合物(XXXXI-2)という〕とした後、必要に応じて保護基を除去することにより化合物(I-26)または(I-27)を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上

またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常 30 分間から 2 日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

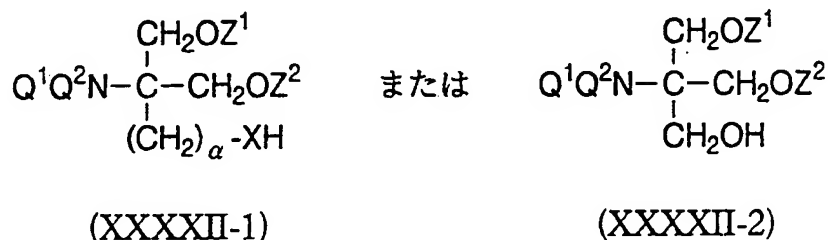
上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXXI-1) または化合物 (XXXXI-2) を精製することができる。

本反応において、X = スルフィニルまたはスルホニルの化合物は、X = 硫黄の化合物を酸化することにより得られる。

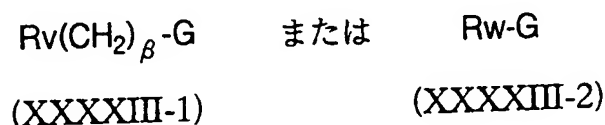
このように本方法は、一般式 (I-26) または (I-27) の化合物の合成に適用することができる。また、化合物 (I-1)、(I-2)、(I-4)、(I-5)、(I-7) ~ (I-11) の合成にも適用することができる。

(S 法) 化合物 (XXXXI-1) または化合物 (XXXXI-2) は次の方法でも製造することができる。

一般式 (XXXXII)



(式中、 Q^1 、 Q^2 、 Z^1 、 Z^2 、X、 α は前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XXXXII-1) または化合物 (XXXXII-2) という〕と一般式 (XXXXIII)



(式中、 R_v 、 R_w 、 G 、 β は前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物 (XXXXIII-1)または化合物 (XXXXIII-2)という〕を塩基の存在下縮合させ、さらに必要に応じて保護基を除去することにより、化合物 (XXXXI-1)または化合物 (XXXXI-2)を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

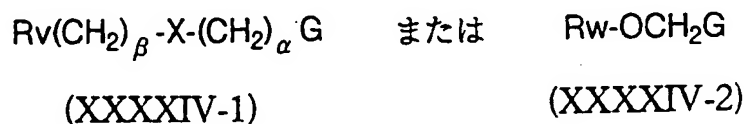
縮合反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

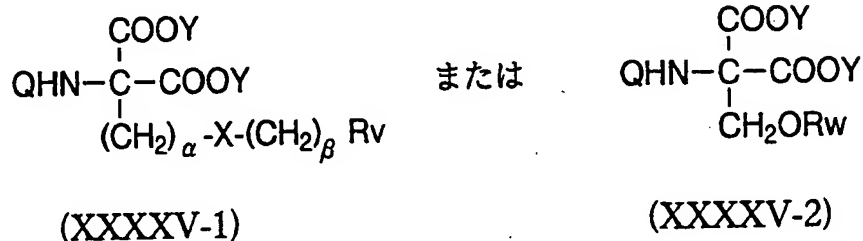
上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXXI-1)または化合物 (XXXXI-2)を精製することができる。

(T法) 化合物 (XXXXI-1)または化合物 (XXXXI-2)は次の方法でも製造することができる。

一般式 (XXXXIV)



(式中、R_v、R_w、G、X、α、βは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXXIV-1)または化合物(XXXXIV-2)という〕と化合物(III)を塩基の存在下縮合させ、一般式(XXXXV)



(式中、R_v、R_w、X、Q、Y、α、βは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXXV-1)または化合物(XXXXV-2)という〕とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて水酸基およびアミノを保護することにより、化合物(XXXXI-1)または化合物(XXXXI-2)を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデカ-7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXXV-1) または化合物 (XXXXV-2) を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

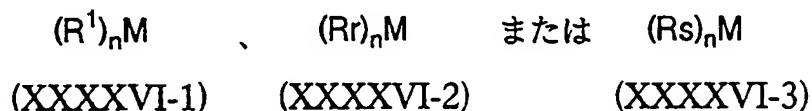
カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

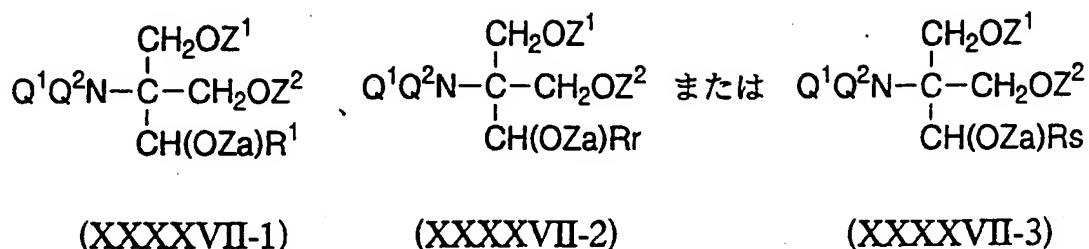
カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXXI-1) または化合物 (XXXXI-2) を精製することができる。

(U法) 化合物 (XIV) に一般式 (XXXXVI)



(式中、 R^1 、 Rr 、 Rs 、 M 、 n は前記と同義である。) で表される化合物 (以下、化合物 (XXXXVI-1)、化合物 (XXXXVI-2) または化合物 (XXXXVI-3) という) を付加させ、さらに必要に応じて水酸基を保護することにより、一般式 (XXV(I))



(式中、 R^1 、 Rr 、 Rs 、 Q^1 、 Q^2 、 Z^1 、 Z^2 、 Za は前記と同義である。) で表される化合物〔以下、化合物 (XXXXVII-1)、化合物 (XXXXVII-2) または化合物 (XXXXVII-3) という〕とした後、必要に応じて保護基を除去することにより化合物 (XXII-1)、化合物 (I-22) または化合物 (I-23) を製造することができる。

付加反応に用いられる溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

付加反応の反応温度は、通常 $-100 \sim 80^\circ\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

付加反応の反応時間は、通常 30 分間から 2 日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により付加反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物 (XXXXVII-1)、化合物 (XXXXVII-2) または化合物 (XXXXVII-3) を精製することができる。

このように本方法は、一般式 (I-21) ~ (I-23) の化合物の合成に適用することができる。

(V法) 一般式 (XXXXVIII)



(式中、Yは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXVIII)という〕と化合物(II)を塩基の存在下縮合させ、一般式(XXXIX)



(式中、R^I、Yは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXIX)という〕とした後、一般式(XXXXX)



(式中、Leは2, 4-ジニトロフェノキシなどの脱離基を示す。)で表されるアミノ化剤を塩基の存在下作用させることにより、一般式(XXXXXI)



(式中、R^I、Yは前記と同義である。)で表される化合物〔以下、化合物(XXXI)という〕とした後、カルボキシを適当な還元剤で還元し、さらに必要に応じて保護基を除去することにより、化合物(1-29)を製造することができる。

縮合反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー-7-エンがあげられる。

縮合反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

縮合反応の反応温度は、通常-20~150℃であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

縮合反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により縮合反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXXIX)を精製することができる。

アミノ化反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、ブチルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラザン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕ウンデカー-7-エンがあげられる。

アミノ化反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ベンゼン、トルエン、キシレン、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、アセトニトリルがあげられる。

アミノ化反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 150^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

アミノ化反応の反応時間は、通常30分間から2日間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件によりアミノ化反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(XXXXXI)を精製することができる。

カルボキシの還元反応に用いられる還元剤としては、例えば水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化アルミニウムリチウム等の金属還元試薬、ジボランがあげられる。

カルボキシの還元反応に用いられる有機溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、第3級ブチルアルコール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテルがあげられる。

カルボキシの還元反応の反応温度は、通常 $-20 \sim 80^{\circ}\text{C}$ であり、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の温度を選択することができる。

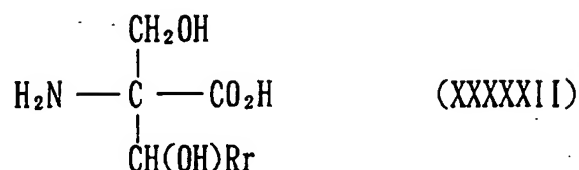
カルボキシの還元反応の反応時間は、通常30分間から10時間の範囲であるが、必要に応じてこれ以上またはこれ以下の時間を選択することができる。

上記反応条件により還元反応を行った後、または必要に応じて保護基を除去した後、有機合成化学の分野における公知の方法、例えば溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー、イオン交換樹脂を用いる方法により化合物(I-29)を精製することができる。

本方法は、一般式(I-1)～(I-18)の化合物の合成に適用することができる。好ましくは一般式(I-12)または(I-13)の化合物の合成に適用することができる。

(W法)

本発明の一般式 (I) の化合物中、R が $-\text{CH}(\text{OH})\text{Rr}$ である化合物は、
一般式



(式中、Rr は前記と同義である。) により表される化合物 (以下、化合物 (XXX
XXII) と称する) またはそのカルボキシル基における誘導体、または Rr におけ
るアルキル基 (鎖中に二重結合またはカルボニルを有していてもよい) の α 位が
水酸基で置換された化合物 (XXXXXII) においては、相当するラクトン化合物、あ
るいは化合物 (XXXXXII) またはラクトン化合物のアミノまたは水酸基が保護基に
より保護された化合物をそれ自体公知の還元反応、水素添加反応またはオゾン分
解反応もしくは酸化反応を単独または任意に組合わせて行うことにより製造され
る。

化合物 (XXXXXII) のカルボキシル基における誘導体としては、エステル (メチ
ルエステル、エチルエステル、ベンジルエステル、p-ニトロベンジルエステル、
トリメチルシリルエステル、第3級ブチルジメチルシリルエステル等)、酸ハラ
イド (酸塩化物等)、酸無水物、混合酸無水物等が挙げられる。

化合物 (I) において、Rr が α 位水酸基置換アルキル基である化合物の場合、
上記したラクトン化合物を出発原料として用いるのが好ましい。

還元反応は、通常錯金属水素化物の存在下、反応に不活性な溶媒中、冷却下か
ら還流下までの温度で進行する。用いる錯金属水素化物としては水素化アルミ
ニウム、水素化アルミニウムリチウム、水素化アルミニウムリチウム-塩化アル
ミニウム、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム、ビス (2-メトキシエト
キシ) 水素化アルミニウムナトリウム、ジイソブチル水素化アルミニウム、水素
化ホウ素ナトリウム、水素化ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化ホウ素
などが挙げられ、溶媒としてはアルコール系溶媒 (メタノール、エタノール、イ

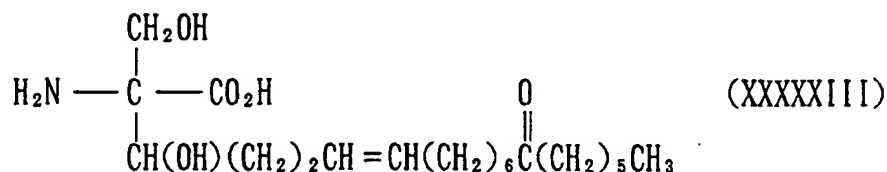
ソプロパノール、ジエチレングリコール等)、炭化水素系溶媒(ベンゼン、トルエン、キシレン等)、ハロ炭化水素系溶媒(塩化メチレン、ジクロロエタン、クロロホルム等)、エーテル系溶媒(ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等)、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等が挙げられる。これらは単独で用いてもよいし、併用することも可能である。

また、還元反応は亜鉛-塩酸飽和無水酢酸、銅クロマイト触媒、パラジウム-炭素、ラネーニッケル、酸化レニウム等を用いた接触還元法や電解還元法も適用可能である。これらの反応もそれ自体公知の反応に準じて進行する。

水素添加反応は、通常パラジウム系、ニッケル系、白金系等の慣用の触媒を用いるそれ自体公知の方法により進行する。反応には不活性な溶媒を用いるが、そのようなものとしては上記した溶媒が例示される。

本発明においては、上記反応において得られた化合物を原料として用いることができる。

化合物(XXXXXII)中、R_rが α 位水酸基置換アルキル基(鎖中に二重結合またはカルボニルを有していてもよい)である化合物、そのラクトン化合物は、前記した特開平1-104087号公報および特開平3-128347号公報により公知であり、それら公報に記載された方法により製造される。化合物(XXXXXII)中、R_rが鎖中に二重結合またはカルボニルを有していてもよいアルキル基(たとえば、ヘプタデシル)である化合物は、たとえば発酵法またはそれにより生産され、式



により表される化合物(XXXXXIII)を出発物質として用いることにより製造される。化合物(XXXXXIII)を生産しうる微生物としては、子とう菌類や不完全菌に属するもの、具体的には不完全菌に属するイザリア属、マイセリア属、子とう菌に

属するマイリオコッカム属(チエラピア属)等が挙げられ、それぞれアメリカン・タイプ・カルチャ・コレクション(American Type Culture Collection)にイザリア・シンクレイリー(*Isaria sinclairii*)ATCC No.24400、マイリオコッカム・アルボマイセス(*Myriococcum albomyces*)ATCC No.16425、マイセリア・ステリリア(*Mycelia sterilia*)ATCC No.20349として寄託されている。また、マイリオコッカム・アルボマイセスATCC No.16425は(財)発酵研究所(大阪)にIF032292として寄託されている。

化合物(XXXXXIII)は上記菌株を、たとえば常用される紫外線、高周波放射線、薬品等による人工変異手段で変更した変異株にて製造することもできる。

化合物(XXXXXIII)生産菌は、通常のかび用栄養源を含む種々の培養基で培養される。たとえば、炭素源としてグルコース、澱粉、グリセリン、糖水あめ、デキストリン、糖蜜、マルトース、キシロース等、および窒素源としてコーンステイプリーカー、ペプトン、イーストエキス、ジャガイモ煎汁、肉汁、大豆粉、小麦胚芽、硝酸カリウム、硝酸ナトリウム、硫酸アンモニウム、カゼイン、グルテンミール、綿実粉、羽毛粉等の無機または有機の窒素化合物が挙げられ、その他通常は無機塩および菌の発育を助け、化合物(XXXXXIII)の生産を促進する有機および無機物や消泡剤等の培養に常用される添加剤を適当に加えることができる。

培養法は特に限定されるものではないが、好気的な深部培養法が適している。培養に適当な温度は、イザリア属に属する菌の場合には20～35℃、好適には25～30℃であり、マイリオコッカム属またはマイセリア属に属する菌の場合には30～50℃、好適には35～45℃である。

培養物中に生産された化合物(XXXXXIII)は抽出、吸着等常用される操作を必要に応じて適宜組み合わせ、培養物中より取り出される。たとえば、イザリア・シンクレイリー等のイザリア属に属する菌の場合は培養液から菌体等の不溶物を濾過、遠心分離等の方法で分離し、培養濾液をアンバーライトXAD-2(商品名)に通液させ、化合物(XXXXXIII)を吸着させることによって取り出される。かくして得られた化合物(XXXXXIII)をさらに、例えばメタノールで溶出させ、溶出部をさらに逆相クロマトグラフィーにかけて分画することによって化合物(XXXXXIII)

の高度精製物が得られる。また、マイリオコッカム・アルボマイセス、マイセリア・ステリリア等のマイリオコッカム属またはマイセリア属に属する菌の場合は、培養液から菌体を濾過、遠心分離等の方法で分離し、培養濾液はイザリア属と同様に操作する。一方、分離した菌体からは、メタノールを用いて化合物(XXXXXIII)を抽出し、抽出液を濾液と同様にアンバーライトXAD-2で処理し、クロマトグラフィーや再結晶により精製し、化合物(XXXXXIII)を得る。

本発明の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物、その異性体またはそれらの塩はすぐれた免疫抑制作用を示し、ヒト、ウシ、ウマ、イヌ、マウス、ラット等の哺乳動物に対して、たとえば臓器や骨髄移植の際の拒絶反応の抑制剤や、関節リウマチ、アトピー性湿疹（アトピー性皮膚炎）、ベーチェット病、ブドウ膜病、全身性エリテマトーデス、シュレーレン病、多発性硬化症、重症筋無力症、I型糖尿病、内分泌性眼障害、原発性胆汁性肝硬変、クローン病、糸球体腎炎、サルコイドーシス、乾癬、天疱瘡、再生不良性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、アレルギー、結節性多発動脈炎、進行性全身性硬化症、混合性結合組織病、大動脈炎症候群、多発性筋炎、皮膚筋炎、Wegener肉芽腫、潰瘍性大腸炎、活動性慢性肝炎、自己免疫性溶血性貧血、Evans症候群、気管支喘息、花粉症等の自己免疫疾患等における予防または治療剤として、あるいは医学、薬学における試薬として用いることができる。また、保護基により保護された化合物は、これらすぐれた薬理作用等を有する化合物の合成中間体として有用である。

これらの化合物類を医薬として用いる場合、通常その有効成分量を担体、賦形剤、希釈剤等と混合して散剤、カプセル剤、錠剤、注射剤等に製剤化して患者に投与することができる。また、それ自体既知手段にて凍結乾燥製剤としてもよい。

これらの化合物類の投与量は疾患、症状、体重、性別、年齢等によって変わらうが、例えば腎移植における拒絶反応の抑制には、通常成人1日当たり0.01~10mg（力価）を1日1~数回に分けて投与される。

また、本発明の化合物は、シクロスポリン、アザチオプリン、ステロイド剤、FK-506（EP-A184162公報）等の免疫抑制剤と併用することができる。

以下、実施例により本発明を具体的に説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例 1

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル 3.0 g を乾燥エタノール 50 ml に溶解し、これにナトリウムエトキシド 1.13 g を加えた。この混合溶液に室温で攪拌しながら、テトラデシルブロマイド 4.7 g を乾燥エタノール 20 ml に溶解した溶液を加えた。反応器内を窒素で置換し、約 15 時間還流した後、1 N 塩酸水溶液で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-テトラデシルマロン酸ジエチル 3.5 g を得た。

融点 = 58.5 ~ 60.5 °C

I R (KBr): 3280, 2970, 2930, 2860, 1750, 1655, 1525, 1480, 1220,
1030 cm^{-1}

(2) 2-アセトアミド-2-テトラデシルマロン酸ジエチル 3.40 g を乾燥テトラヒドロフラン 200 ml に溶解し、塩化カルシウム管をつけ、氷水浴中で水素化アルミニウムリチウム 1.58 g を加え、攪拌した。その後、室温で 30 分攪拌した後、水 3.0 ml を加えて反応を停止した。反応混合液を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸 100 ml、ピリジン 80 ml を加えて室温で一夜攪拌した。反応混合物を氷水に投じて全容を 1600 ml とし、これを酢酸エチル 500 ml で 3 回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1 N 塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後、濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシー-2-テトラデシルプロパン 1.35 g を得た。

融点 = 84.0 ~ 85.5 °C

I R (KBr): 3310, 2950, 2920, 2840, 1750, 1655, 1550, 1470, 1375, 1255,
1230, 1035, 900 cm^{-1}

実施例 2

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-テトラデシルプロパン 1. 25 gをメタノール 100 mlに溶解し、1 N水酸化ナトリウム水溶液 19.4 mlを加えて、6時間加熱還流した。1 N塩酸水溶液で中和した後、減圧下に濃縮し、濃縮残渣を水、酢酸エチル：ヘキサン=1：1で順次洗浄し、2-アミノ-2-テトラデシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩 791 mgを得た。

融点=96.5~98.5℃

Rf: 0.55 (クロロホルム：メタノール：水=65：35：5)

IR (KBr): 3520, 3450, 3300, 3050, 2920, 2850, 1630, 1530, 1470, 1290, 1070, 1050 cm^{-1}

実施例 3

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル 3.0 gを乾燥エタノール 50 mlに溶解し、これにナトリウムエトキシド 1.13 gを加えた。この混合溶液に室温で攪拌しながら、ヘキサデシルブロマイド 5.5 gを乾燥エタノール 20 mlに溶解した溶液を加えた。反応器内を窒素で置換し、約15時間還流した後、1 N塩酸水溶液で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-ヘキサデシルマロン酸ジエチル 4.37 gを得た。

融点=65.0~67.0℃

IR (KBr): 3300, 2920, 2850, 1745, 1650, 1515, 1210, 1020 cm^{-1}

(2) 2-アセトアミド-2-ヘキサデシルマロン酸ジエチル 4.30 gを乾燥テトラヒドロフラン 200 mlに溶解し、塩化カルシウム管をつけ、氷水浴中で水素化アルミニウムリチウム 1.90 gを加え、攪拌した。その後、室温で30分攪拌した後、水 3.6 mlを加えて反応を停止した。反応混合液を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸 100 ml、ピリジン 80 mlを加えて室温で一夜攪拌した。反応混合物を氷水に投じて全容を 1600 mlとし、これを酢酸エチル 500 mlで3回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1 N塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後、濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精

製し、2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-ヘキサデシルプロパン1.83gを得た。

融点=84~86°C

IR (KBr): 3300, 2920, 2850, 1740, 1655, 1560, 1390, 1270, 1240,
1055 cm⁻¹

実施例 4

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-ヘキサデシルプロパン1.75gをメタノール100mlに溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液23.8mlを加えて、6時間加熱還流した。1N塩酸水溶液で中和した後、減圧下に濃縮し、濃縮残渣を水、酢酸エチル:ヘキサン=1:1で順次洗浄し、2-アミノ-2-ヘキサデシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩892mgを得た。

融点=100.5~104.0°C

Rf: 0.55 (クロロホルム:メタノール:水=65:35:5)

IR (KBr): 3350, 2920, 2850, 1590, 1470, 1050 cm⁻¹

実施例 5

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル5.0gを乾燥エタノール64mlに溶解し、これにナトリウムエトキシド1.71gを加えた。この混合溶液に室温で攪拌しながら、オクタデシルブロマイド8.4gを乾燥エタノール20mlに溶解した溶液を加えた。反応器内を窒素で置換し、約15時間還流した後、1N塩酸水溶液で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-オクタデシルマロン酸ジエチル6.4gを得た。

融点=70~71°C

¹H-NMR (200MHz, CDCl₃) δ:

6.77 (1H, br. s, -NH-), 4.24 (4H, q, J=7.16Hz, -OCH₂-×2),

2.35-2.26 (2H, m, C₃-Ha, Hb), 2.03 (3H, s, CH₃CONH-),

1.25 (38H, m, O-CH₂-CH₃ ×2, CH₂ ×16),

0.88 (3H, t, J=6.47Hz, CH₃)

IR : 3260, 2910, 2850, 1745, 1640, 1515, 1210, 1020 cm^{-1}

(2) 2-アセトアミド-2-オクタデシルマロン酸ジエチル 3.0 g を乾燥テトラヒドロフランに溶解し、塩化カルシウム管をつけ、氷水浴中で水素化アルミニウムリチウム 1.2 g を加え、攪拌した。その後、室温で 30 分攪拌した後、水 2.31 g を加えて反応を停止した。反応混合液を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸 130 ml、ピリジン 120 ml を加えて室温で一夜攪拌した。その後、反応混合物を氷水に投じて全容を 2200 ml とし、これを酢酸エチル 700 ml で 3 回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1 N 塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後、濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-オクタデシルプロパン 1.7 g を得た。

融点 = 90 ~ 91 °C

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ :

5.64 (1H, br. s, -NH-), 4.30 (4H, s, $-\text{CH}_2\text{O}-\times 2$),

2.09 (6H, s, $\text{OCOCH}_3 \times 2$), 1.97 (3H, s, NHCOCH_3),

1.25 (34H, br. s, $\text{CH}_2 \times 17$), 0.88 (3H, t, $J=6.47\text{Hz}$, CH_3)

IR : 3280, 2920, 2850, 1750, 1735, 1645, 1565, 1385, 1270, 1240,
1045 cm^{-1}

実施例 6

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-オクタデシルプロパン 1.0 g をメタノール 26 ml に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 6.4 ml を加えて、6 時間加熱還流した。1 N 塩酸水溶液で中和した後、減圧下に濃縮し、濃縮残渣を水、酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 1 で順次洗浄し、2-アミノ-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩 639 mg を得た。

融点 = 108.5 ~ 109.5 °C

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CD_3OD) δ :

3.64 (2H, d, $J=11.48\text{Hz}$, $-\text{CHa-O}-$),

3.57 (2H, d, $J=11.47\text{Hz}$, $-\text{CHb}-\text{O}-$),

1.28 (34H, br.s, $\text{CH}_2 \times 17$),

0.90 (3H, t, $J=6.35\text{Hz}$, $-\text{CH}_3$.)

I R : 3275, 2900, 2840, 1630, 1600, 1530, 1465, 1290, 1050 cm^{-1}

実施例 7

実施例 5 で得られた 2-アミノ-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩 100 mg をメタノール 200 ml に溶解後、ダイアイオン WA-10 (商品名; 陰イオン交換樹脂) 50 ml に滴液した。溶出液の溶媒を留去し、2-アミノ-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール 64 mg を得た。

融点 = 76.0 ~ 80.0 $^{\circ}\text{C}$

I R : 3290, 3175, 2910, 2850, 1590, 1580, 1480, 1065, 1050, 1000 cm^{-1}

実施例 8

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル 3.0 g を乾燥エタノール 50 ml に溶解し、これにナトリウムエトキシド 1.3 g を加えた。この混合溶液に室温で攪拌しながら、臭化ドコシル 6.5 g を乾燥エタノール 20 ml に溶解した溶液を加えた。反応器内を窒素で置換し、約 15 時間還流した。1 N 塩酸水溶液で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-ドコシルマロン酸ジエチル 4.2 g を得た。

融点 = 79 ~ 80 $^{\circ}\text{C}$

I R (KBr) : 3300, 2925, 2860, 1750, 1655, 1520, 1220 cm^{-1}

(2) 2-アセトアミド-2-ドコシルマロン酸ジエチル 4.15 g を乾燥テトラヒドロフランに溶解し、塩化カルシウム管をつけ氷水浴中で水素化アルミニウムリチウム 1.4 g を加え攪拌した。室温で 30 分攪拌した後、水 2.31 g を加え反応を停止した。反応混合物を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸 130 ml、ピリジン 120 ml を加えて室温で一夜攪拌した。その後、反応混合物を氷水に投じて全容を 2200 ml とし、これを酢酸エチル 700 ml で 3 回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1 N 塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後濃縮し、

濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-ドコシルプロパン 1.8 gを得た。

融点 = 94 ~ 95 °C

I R (KBr): 3280, 2920, 2850, 1750, 1655, 1520, 1480, 1220 cm^{-1}

実施例 9

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-ドコシルプロパン 1.5 gをメタノール 40 ml に溶解し、1 N水酸化ナトリウム水溶液 9.6 mlを加えて6時間加熱還流した。1 N塩酸水溶液で中和した後、減圧下に濃縮し、濃縮残渣を水、酢酸エチル:ヘキサン = 1:1で順次洗浄し、2-アミノ-2-ドコシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩 846 mgを得た。

融点 = 109.0 ~ 110.5 °C

R_f: 0.55 (クロロホルム:メタノール:水 = 65:35:5)

I R (KBr): 3500, 3450, 3290, 2920, 2850, 1640, 1530, 1470, 1060 cm^{-1}

実施例 10

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル 3.0 gを乾燥エタノール 50 ml に溶解し、これにナトリウムエトキシド 1.3 gを加えた。この混合溶液に室温で攪拌しながら、臭化エイコシル 6.0 gを乾燥エタノール 20 ml に溶解した溶液を加えた。反応器内を窒素で置換し、約15時間還流した後、1 N塩酸水溶液で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-エイコシルマロン酸ジエチル 4 gを得た。

融点 = 76.5 ~ 77.5 °C

I R (KBr): 2920, 2850, 1750, 1655, 1520, 1480, 1220 cm^{-1}

(2) 2-アセトアミド-2-エイコシルマロン酸ジエチル 3.7 gを乾燥テトラヒドロフランに溶解し、塩化カルシウム管をつけ、0 °Cに冷却した。これに水素化アルミニウムリチウム 1.4 gを加え攪拌した。その後室温で30分攪拌した後、水 2.31 gを加え反応を停止した。反応混合物を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸 130 ml、ピリジン 120 mlを加えて室温で一夜攪拌した。その後、反応混合物を氷水に投じて全容を 2200 mlとし、これを酢酸エチル 7

00 ml で3回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1 N塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後濃縮し、濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-エイコシルプロパン 1.7 gを得た。

融点 = 93 ~ 94 °C

I R (KBr): 3280, 2920, 2855, 1775, 1755, 1650, 1565, 1480, 1385,
1270, 1245, 1045 cm^{-1}

実施例 11

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-エイコシルプロパン 1.5 g をメタノール 40 ml に溶解し、1 N水酸化ナトリウム水溶液 9.6 ml を加えて6時間加熱還流した。反応液を1 N塩酸水溶液で中和した後、減圧下に濃縮し、濃縮残渣を水、酢酸エチル:ヘキサン = 1:1 で順次洗浄し、2-アミノ-2-エイコシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩 817 mg を得た。

融点 = 109.5 ~ 111.0 °C

R f : 0.55 (クロロホルム:メタノール:水 = 65:35:5)

I R (KBr): 3300, 2910, 2850, 1640, 1600, 1480, 1065, 1050 cm^{-1}

実施例 12

(1) 2-アセトアミドマロン酸ジエチル 15 g を乾燥エタノール 200 ml に溶解し、これにナトリウムエトキシド 5.6 g を加えた。この混合溶液に室温で攪拌しながら、9-オクタデセニルクロライド 22 g を加え、反応器内を窒素で置換し、約15時間還流した。その後、エタノール-濃塩酸 (11:1) で中和し濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-(9-オクタデセニル)マロン酸ジエチル 1.3 g を無色油状粘稠物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ :

6.765 (1H, br. s, -NH-), 5.340-5.310 (2H, m, CH=CH),

4.240 (4H, q, $J=7.4\text{Hz}$, $-\text{OCH}_2-$ $\times 2$), 2.032 (3H, s, CH_3CON),

1.990 (4H, m, $\text{CH}_2\text{CH=}$ $\times 2$), 1.252 (26H, m, CH_2 $\times 13$),
 1.252 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$, OCH_2 CH_3 $\times 2$),
 0.880 (3H, t, $J=6.5\text{Hz}$, CH_3)

(2) 2-アセトアミド-2-(9-オクタデセニル)マロン酸ジエチル 1.3 g
 を乾燥テトラヒドロフラン 30 ml に溶解し、氷冷下、水素化アルミニウムリチウム 450 mg を加え、乾燥窒素で反応器内を置換し、攪拌した。その後、室温で2時間攪拌し、水 1 ml を加えて反応を停止した。この反応混合液を減圧下に濃縮し、濃縮残渣に無水酢酸 10 ml、ピリジン 5 ml を加えて室温で一夜攪拌した。その後、反応混合液に氷冷下、水を加えて全容を約 100 ml とし、これを酢酸エチル 50 ml で2回抽出した。酢酸エチル層を合わせ、1 N 塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで脱水後、濃縮し、2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(9-オクタデセニル)プロパン 430 mg を無色油状粘稠物として得た。
 IR (CHCl_3) : 3460, 3420, 3010, 2940, 2860, 1750, 1690, 1520, 1475,
 1390, 1380, 1240(br), 1045, 990 cm^{-1}

実施例 13

2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(9-オクタデセニル)プロパン 332 mg をメタノール 30 ml に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 7.8 ml を加えて、一夜加熱還流した。その後、メタノール-濃塩酸 (1:1) で中和し、減圧下濃縮した。濃縮残渣をメタノール-水 (1:1) に溶解し、逆相カラムクロマト〔充填剤: Sep-Pak(C_{18})〕に付し、水洗した後、メタノールで溶出した。その溶出液を濃縮し、2-アミノ-2-(9-オクタデセニル)-1,3-プロパンジオール塩酸塩 209 mg を無色油状粘稠物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CD_3OD) δ :

5.385-5.315 (2H, m, CH=CH), 3.616 (2H, d, $J=11.4\text{Hz}$, OCH_2 $\times 2$),
 3.548 (2H, d, $J=11.4\text{Hz}$, OCH_2 $\times 2$),
 2.071-1.957 (4H, m, $\text{CH}_2\text{CH=}$ $\times 2$), 1.655-1.580 (2H, m, CCH_2),
 1.39-1.28 (24H, m, CH_2 $\times 12$), 0.896 (3H, t, $J=6\text{Hz}$, CH_3)

IR : 3300(br), 2920, 2850, 1600, 1500, 1465, 1050, 965 cm^{-1}

実施例 1 4

(1) 無水エタノール 15 ml に氷冷下、ナトリウム 0.23 g を加え、窒素ガス気流下、室温で 30 分間攪拌し、ナトリウムエトキシドのエタノール溶液 10 mmol を調製した。この溶液に、2-アセトアミドマロン酸ジエチル 1.98 g を加え、窒素気流下 30 分間、50°C で加熱した後、室温で 3-フェニルプロピルブロマイドを加え、24 時間加熱還流した。希塩酸で中和し、エタノールを留去した残渣を酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン = 1 : 4 ~ 1 : 1）にて精製し、ジイソプロピルエーテル-ヘキサンの再結晶し、2-アセトアミド-2-(3-フェニルプロピル)マロン酸ジエチル 800 mg を白色結晶として得た。

融点 = 76 ~ 77°C

Rf : 0.58 (酢酸エチル：ヘキサン = 1 : 1)

$^1\text{H-NMR}$ (90MHz, CDCl_3) δ :

1.22 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.10-1.56 (4H, m), 2.02 (3H, s),

2.28-2.75 (2H, m), 4.21 (4H, q, $J=7\text{Hz}$), 6.75 (1H, br.s),

7.02-7.42 (5H, m)

IR ν : 3259, 2980, 2863, 1738, 1648 cm^{-1}

MS (EI) : 335(M^+)

(2) 上記化合物 1.0 g と水素化ホウ素リチウム 136 mg のテトラヒドロフラン溶液 50 ml を窒素気流下、1 時間加熱還流した。反応液を 100 ml の氷水にあけ、酢酸エチルにて抽出後、洗浄、乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム = 1 : 20）で精製し、2-アセトアミド-2-(3-フェニルプロピル)-1,3-プロパンジオール 720 mg を無色油状物質として得た。

Rf : 0.30 (酢酸エチル)

$^1\text{H-NMR}$ (90MHz, CDCl_3) δ :

1.47-1.89 (4H, m), 2.00 (3H, s), 2.44-2.84 (2H, m),
3.73 (4H, dd, J=7Hz, 15Hz), 3.37-4.17 (2H, m),
5.51-5.97 (1H, m), 7.00-7.45 (5H, m)

IR ν : 3294, 2938, 1652 cm^{-1}

MS (EI): 251(M^+)

実施例 15

2-アセトアミド-2-(3-フェニルプロピル)-1, 3-プロパンジオール 600 mg をメタノール 25 ml に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 11.9 ml を加えて 6 時間加熱還流した。30 ml の氷水にあげ、希塩酸で中和後、溶媒を留去した。残渣にクロロホルムを加えて抽出後、クロロホルム層を洗浄、乾燥後、溶媒を留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー (クロロホルム: メタノール = 9:1 ~ 4:1) にて精製して、2-アミノ-2-(3-フェニルプロピル)-1, 3-プロパンジオール 250 mg を淡黄色油状物質として得た。

Rf: 0.22 (メタノール: クロロホルム = 1:4)

$^1\text{H-NMR}$ (90MHz, CDCl_3) δ :

1.11-1.98 (4H, m), 2.43-2.75 (2H, m), 3.15-4.03 (4H, m),
3.62 (4H, br.s), 7.19 (5H, s)

IR ν : 3347, 3023, 2937, 1583 cm^{-1}

MS (EI): 209 ($\text{M}+1$)

実施例 16

(1) 臭化シンナミル 5.42 g、2-アセトアミドマロン酸ジエチル 5.43 g およびナトリウムエトキシド 1.87 g のエタノール 70 ml 溶液を窒素下、2 時間加熱還流した。200 ml の氷水にあげ、酢酸エチルにて抽出後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (酢酸エチル: ヘキサン = 1:10 ~ 1:3) にて精製し、2-アセトアミド-2-(3-フェニル-2-プロペニル) マロン酸ジエチル 2.68 g を白色結晶として得た。

融点 = 70 ~ 75 $^{\circ}\text{C}$

Rf : 0.38 (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 5)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

1.31 (6H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 1.56 (2H, s), 2.09 (3H, s),

4.28 (4H, q, $J=7.5\text{Hz}$), 6.30-6.80 (2H, m), 7.27 (5H, s)

IR (KBr) : 3280, 2990, 1740, 1640 cm^{-1}

(2) 上記化合物 2.50 g と水素化ホウ素リチウム 1.63 g のテトラヒドロフラン溶液 80 ml を窒素気流下、2 時間加熱還流した。反応後溶媒を留去し、乾固した。残渣に無水酢酸 14 ml とピリジン 50 ml を加え、一夜室温で撹拌した。氷水にあげ酢酸エチルにて抽出した。抽出液を 2 N 塩酸、飽和重曹水、飽和食塩水にて順次洗浄した後、乾燥して溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : ヘキサン = 3 : 1) にて精製して、2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(3-フェニル-2-プロペニル) プロパン 200 mg を白色結晶として得た。

融点 = 88 ~ 90 $^{\circ}\text{C}$

Rf : 0.70 (酢酸エチル)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

1.96 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.82 (2H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 4.36 (4H, s)

IR (KBr) : 3311, 3084, 1750, 1655, 1560 cm^{-1}

MS : 333 (M^+)

元素分析 : 計算値 C 64.85, H 6.95, N 4.20

分析値 C 64.85, H 6.88, N 4.15

実施例 17

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(3-フェニル-2-プロペニル) プロパン 170 mg をメタノール 6 ml に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 6 ml を加えて、3 時間加熱還流した。反応後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (メタノール : クロロホルム = 1 : 3.0 ~ 1 : 6) にて精製し、2-アミノ-2-(3-フェニル-2-プロペニル)-1, 3-プロパンジオール 70 mg を淡褐色結晶として得た。

R f : 0. 1 4 (メタノール : クロロホルム = 1 : 1 0)

I R (KBr) : 3367, 2935, 1556 cm^{-1}

実施例 1 8

(1) 1-フェニル-1-プロピン-3-オール 5 g、トシルクロライド 5. 1 g およびピリジン 2 0 m l を室温で 1 時間攪拌した。氷水 1 0 0 m l にあけて、酢酸エチルで抽出後、油層を 1 N 塩酸と飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 5) にて精製し、3-フェニル-2-プロピニルクロライド 2. 5 4 g を淡黄色油状物質として得た。

R f : 0. 8 1 (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

4.37 (2H, s), 7.23-7.60 (5H, m)

I R (neat) : 2222, 758, 690 cm^{-1}

MS (70eV) : 150 (M^+)

(2) 上記化合物 2. 5 g、2-アセトアミドマロン酸ジメチル 3. 7 9 g およびナトリウムエトキシド 1. 4 3 g のエタノール 5 0 m l 溶液を窒素下、3 時間加熱還流した。2 0 m l の水で反応を停止し、酢酸エチルで抽出後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 7 ~ 1 : 2) にて精製し、2-アセトアミド-2-(3-フェニル-2-プロピニル) マロン酸ジエチル 2. 5 g を白色結晶として得た。

融点 = 9 4 ~ 9 6. 5 $^{\circ}\text{C}$

R f : 0. 3 8 (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

1.28 (6H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.08 (3H, s), 3.49 (2H, s),

4.30 (4H, q, $J=7.5\text{Hz}$), 6.98 (1H, br.s), 7.16-7.49 (5H, m)

I R (KBr) : 3260, 1747, 1643, 1197 cm^{-1}

MS (70eV) : 331 (M^+)

(3) 上記化合物 1. 8 g と水素化ホウ素リチウム 0. 47 g のテトラヒドロフラン溶液 50 ml を窒素下、1. 5 時間加熱還流した。放冷後、1 N 塩酸水溶液 8 ml にて中和し、乾固した。残渣に無水酢酸 4 ml とピリジン 30 ml を加え、室温にて 2. 5 時間攪拌した。反応液を氷水にあけクロロホルムで抽出し、抽出液を 1 N 塩酸、飽和食塩水にて順次洗浄し、乾燥後溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝2：1）にて精製し、2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-（3-フェニル-2-プロピニル）プロパン 430 mg を無色油状物として得た。

R_f : 0. 64 (酢酸エチル)

¹H-NMR (CDCl₃/TMS) δ :

1.98 (3H, s), 2.07 (6H, s), 3.09 (2H, s), 4.47 (4H, s),

5.95 (1H, br.s), 7.18-7.48 (5H, m)

I R (neat) : 3293, 2135, 1745, 1662 cm⁻¹

MS (70eV) : 331(M⁺)

実施例 19

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-（3-フェニル-2-プロピニル）プロパン 430 mg をメタノール 8 ml に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 8 ml を加え、2 時間加熱還流した。溶媒を留去後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝1：50～1：7）にて精製して、2-アミノ-2-（3-フェニル-2-プロピニル）-1, 3-プロパンジオール 230 mg を淡黄色アモルファス様固体として得た。

R_f : 0. 20 (メタノール：クロロホルム＝1：5)

I R (KBr) : 3281, 2932, 1558, 1049 cm⁻¹

実施例 20

(1) 4-（4-ブチルフェニル）ブタノール 1. 1 g、トシルクロライド 1. 05 g、ピリジン 0. 48 ml と触媒量のジメチルアミノピリジンのジクロロメタン溶液を室温で一夜放置した。氷水 50 ml にあけて、クロロホルムにて抽出後無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロ

マトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝１：６）にて精製し、４－（４－ブチルフェニル）ブチル p-トルエンスルホナート 1. 2814 g を無色油状物質として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.96 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.50-2.00 (8H, m), 2.48 (3H, s),

2.40-2.75 (4H, m), 4.08 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 7.07 (4H, m),

7.36 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.83 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)

IR : 2956, 2929, 2858, 1361 cm^{-1}

MS : 360(M^+)

(2) 上記化合物 1. 2138 g とヨウ化ナトリウム 0. 606 g を 2-ブタノン 34 ml に溶解し、4 時間加熱還流した。氷水 100 ml にあけて、酢酸エチルにて抽出後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝１：９）にて精製し、４－（４－ブチルフェニル）－１－ヨードブタン 0. 953 g を赤色油状物質として得た。

Rf : 0. 75 (酢酸エチル：ヘキサン＝１：５)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.92 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.10-2.05 (8H, m), 2.59 (4H, t, $J=7.5\text{Hz}$),

3.20 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.07 (5H, s)

(3) 上記化合物 953. 4 mg、2-アセトアミドマロン酸ジエチル 687. 7 mg およびナトリウムメトキシド 260 mg のエタノール 10 ml 溶液を窒素下、3 時間加熱還流した。100 ml の氷水にあけ、酢酸エチルにて抽出後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝１：３～１：２）にて精製し、2-アセトアミド-2-〔４－（４－ブチルフェニル）ブチル〕マロン酸ジエチル 480 mg を白色結晶として得た。

融点＝60～61 $^{\circ}\text{C}$

Rf : 0. 38 (酢酸エチル：ヘキサン＝１：２)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.93 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.24 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.09-1.85 (8H, m),

2.02 (3H, s), 2.35 (2H, m), 2.58 (4H, t, $J=7.5\text{Hz}$),

4.25 (2H, q, $J=6\text{Hz}$), 6.75 (1H, br.s), 7.07 (4H, s)

I R : 3270, 2930, 2850, 1740, 1640 cm^{-1}

MS : 405(M^+), 290

元素分析 : 計算値 C 68.12, H 8.70, N 3.45

分析値 C 68.25, H 8.69, N 3.55

(4) 上記化合物 450 mg と水素化ホウ素リチウム 100 mg のテトラヒドロフラン溶液 15 ml を窒素下、2 時間加熱還流した。2 N 塩酸水溶液 2.5 ml にて中和した後、乾固した。残渣に無水酢酸 2 ml とピリジン 4 ml を加え、一夜、室温で攪拌した。氷水にあげ酢酸エチルにて抽出した。抽出液を 2 N 塩酸、飽和重曹水、飽和食塩水にて順次洗浄した後、乾燥して溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : ヘキサン = 3 : 1) にて精製して、2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[4-(4-ブチルフェニル)ブチル]プロパン 72.4 mg を白色結晶として得た。

融点 = 68 ~ 71 $^{\circ}\text{C}$

R f : 0.63 (酢酸エチル)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.91 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.10-2.40 (10H, m), 1.93 (3H, s),

2.06 (6H, s), 2.58 (4H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 4.28 (4H, s),

5.62 (1H, br.s), 7.07 (4H, s)

I R : 3298, 3090, 2931, 2859, 1739, 1652, 1557 cm^{-1}

MS : 405(M^+)

元素分析 : 計算値 C 68.12, H 8.70, N 3.45

分析値 C 67.95, H 8.52, N 3.44

実施例 21

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[4-(4-ブチルフェニル)

ブチル] プロパン 66. 2 mg をメタノール 2 ml に溶解し、1 N の水酸化ナトリウム水溶液 2 ml を加えて、4 時間加熱還流した。溶媒を留去した後、シリカゲル薄層クロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム=1：4）にて精製して、2-アミノ-2-[4-(4-ブチルフェニル)ブチル]-1, 3-プロパンジオール 24. 9 mg を白色結晶として得た。

融点=92~94℃

R_f: 0. 15 (メタノール：クロロホルム=1：4)

IR: 3276, 2928, 2858, 1560 cm⁻¹

実施例 22

(1) 4-(4-ヘキシルフェニル)ブタノール 5. 0 g をピリジン 20 ml に溶解し、トシルクロライド 4. 88 g を加えた。反応液を室温で終夜放置した。氷水にあけ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を 2 N 塩酸、飽和重曹水、飽和食塩水にて順次洗浄し、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン=1：7）にて精製して、4-(4-ヘキシルフェニル)ブチル p-トルエンスルホナート 2. 21 g を無色油状物質として得た。

R_f: 0. 35 (酢酸エチル：ヘキサン=1：5)

¹H-NMR (CDCl₃/TMS) δ:

0.90 (3H, t, J=6Hz), 1.09-1.85 (12H, m), 2.46 (3H, s),

2.53 (4H, m), 4.06 (2H, t, J=6Hz), 7.06 (4H, s),

7.34 (2H, d, J=8Hz), 7.81 (2H, d, J=8Hz)

IR: 2927, 2856, 1599 cm⁻¹

MS: 388(M⁺), 216

元素分析: 計算値 C 71.10, H 8.30

分析値 C 71.35, H 8.34

(2) 上記化合物 2. 21 g とヨウ化ナトリウム 1. 02 g を2-ブタノン 57 ml に溶解し、2 時間加熱還流した。氷水にあけて、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄後、乾燥して濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン=1：9）にて精製して、4-(4-ヘキシ

ルフェニル) - 1 - ヨードブタン 1. 7650 g を無色油状物質として得た。

Rf : 0.43 (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 5)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.90 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.05-2.05 (12H, m), 2.60 (4H, m),

3.21 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.10 (4H, s)

MS : 344(M^+), 273, 175

元素分析 : 計算値 C 55.82, H 7.32

分析値 C 55.81, H 7.32

(3) 上記化合物 1. 6806 g、2-アセトアミドマロン酸ジエチル 1. 1133 g およびナトリウムエトキシド 523 mg のエタノール 20 ml 溶液を窒素下、4.5 時間加熱還流した。氷水にあげ、酢酸エチルにて抽出した。抽出液を乾燥して、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 3) にて精製して、2-アセトアミド-2-[4-(4-ヘキシルフェニル)ブチル]マロン酸ジエチル 870 mg を白色結晶として得た。

融点 = 57 ~ 58 °C

Rf : 0.42 (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.91 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.24 (6H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.08-1.90 (12H, m),

2.02 (3H, s), 2.35 (2H, m), 2.58 (4H, t, $J=7\text{Hz}$),

4.23 (4H, q, $J=7\text{Hz}$), 6.74 (1H, br.s), 7.07 (4H, s)

IR : 3270, 2927, 2858, 1746, 1644, 1514 cm^{-1}

MS : 433(M^+), 360, 318

元素分析 : 計算値 C 69.25, H 9.07, N 3.23

分析値 C 69.44, H 8.97, N 3.26

(4) 上記化合物 840 mg と水素化ホウ素リチウム 211 mg のテトラヒドロフラン溶液 20 ml を窒素下、4 時間加熱還流した。2N 塩酸で中和後、溶媒を留去して乾固した。残渣を無水酢酸 5.5 ml とピリジン 16 ml に溶解し、室温で一夜攪拌した。常法処理して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフ

ィー（酢酸エチル：ヘキサン＝3：1）にて精製して、2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[4-(4-ヘキシルフェニル)ブチル]プロパン2,4,4,5mgを白色結晶として得た。

融点＝61～64℃

Rf：0.71（酢酸エチル）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.88 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.10-1.90 (14H, m), 1.92 (3H, s),

2.04 (6H, s), 2.58 (4H, t, $J=7\text{Hz}$), 4.28 (4H, s),

5.58 (1H, br.s), 7.06 (4H, s)

IR : 3313, 2928, 2856, 1750, 1656 cm^{-1}

MS : 433(M^+), 389, 373

元素分析：計算値 C 69.25, H 9.07, N 3.23

分析値 C 69.26, H 9.01, N 3.22

実施例 23

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[4-(4-ヘキシルフェニル)ブチル]プロパン2,4,4,5mgをメタノール7mlに溶解し、1N水酸化ナトリウムを加えて、5時間加熱還流した。溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲル薄層クロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝1：3）にて精製して、2-アミノ-2-[4-(4-ヘキシルフェニル)ブチル]-1, 3-プロパンジオール79.7mgを白色結晶として得た。

融点＝99～102℃

Rf：0.14（メタノール：クロロホルム＝1：4）

IR : 3286, 2927, 2858, 1562, 1514 cm^{-1}

実施例 24

(1) 濃硝酸13.94gに氷冷下、濃硫酸18.3gをゆっくり滴下し、そのまま10分間はげしく攪拌した。この混合溶液に、-20℃にてプロピルブロマイド10gをゆっくり滴下し、-20℃で1時間攪拌した。反応液を氷水500mlにあげ、エーテルにて抽出後、洗浄、乾燥後、溶媒を留去し、残渣をカラムク

ロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝１：９）にて精製し、３－（４－ニトロフェニル）プロピルブロマイド４．５ｇを無色油状物質として得た。

Rf：０．３３（酢酸エチル：ヘキサン＝１：１５）

(2) 無水エタノール４０ｍｌに氷冷下、ナトリウム０．６８ｇを加え、窒素気流下、室温で３０分間攪拌し、ナトリウムエトキシド溶液を調製した。この溶液に、２－アセトアミドマロン酸ジエチル１．９８ｇを加え、上記(1)の化合物４．８ｇを滴下し、６時間加熱還流した。１００ｍｌの氷水にあけ、酢酸エチルにて抽出後、洗浄、乾燥し、溶媒を留去した残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝１：３～１：１）にて精製して、２－アセトアミド－２－〔３－（４－ニトロフェニル）プロピル〕マロン酸ジエチル３．０ｇを黄色油状物質として得た。

Rf：０．５１（酢酸エチル：ヘキサン＝１：１）

(3) 上記(2)の化合物１．０ｇと水素化ホウ素リチウム２２８ｍｇのテトラヒドロフラン溶液５０ｍｌを窒素気流下、２時間加熱還流した。反応液を１００ｍｌの氷水にあけ、酢酸エチルにて抽出後、洗浄、乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム＝１：９）にて精製し、２－アセトアミド－２－〔３－（４－ニトロフェニル）プロピル〕－１，３－プロパンジオール４００ｍｇを黄色油状物質として得た。

Rf：０．２２（酢酸エチル）

$^1\text{H-NMR}$ (90MHz, CDCl_3) δ :

1.38-1.80 (4H, m), 2.00 (3H, s), 2.57-3.04 (2H, m),

3.39-4.28 (4H, m), 3.93 (2H, br.s), 6.23-6.58 (1H, m),

7.17-7.63 (2H, m), 7.75-8.20 (2H, m)

IR ν : 3301, 2944, 1652, 1519 cm^{-1}

MS (EI) : 296(M^+)

実施例 25

２－アセトアミド－２－〔３－（４－ニトロフェニル）プロピル〕－１，３－プロパンジオール４００ｍｇをメタノール５０ｍｌに溶解し、１Ｎ水酸化ナトリ

ウム水溶液 6. 7 m l を加えて 3 時間加熱還流した後、希塩酸で中和後、溶媒を留去し、残渣にクロロホルムを加え、抽出後、クロロホルム層を洗浄、乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（メタノール：クロロホルム=1：4）で精製し、2-アミノ-2-[3-(4-ニトロフェニル)プロピル]-1, 3-プロパンジオール 100 m g を赤色油状物質として得た。

R f : 0. 13 (クロロホルム：メタノール=4：1)

$^1\text{H-NMR}$ (90MHz, CDCl_3) δ :

1.10-2.05 (4H, m), 2.52-3.11 (2H, m), 3.19-3.86 (4H, m),

4.65 (4H, br.s), 7.08-7.65 (3H, m), 7.70-8.18 (1H, m)

I R ν : 3359, 2936, 2866, 1524 cm^{-1}

実施例 26

(1) 3-(3-ヒドロキシフェニル)プロパノール 4. 56 g のエタノール溶液 30 m l に、15 N 水酸化ナトリウム水溶液 2 m l およびウンデシルブロマイド 8. 0 g のエタノール溶液 10 m l を加え、70℃で12時間加熱撹拌した。溶媒を留去し、酢酸エチルにて抽出した。飽和炭酸水素ナトリウムおよび食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン=1：20～1：3）にて精製し、3-(3-ウンデシルオキシフェニル)プロパノール 7. 37 g を無色油状物質として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (90MHz, CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.10-2.08 (20H, m), 1.60 (1H, br.s),

2.69 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 3.55-3.81 (2H, m), 3.94 (3H, t, $J=6\text{Hz}$),

6.62-6.87 (3H, m), 7.06-7.23 (1H, m)

(2) 上記化合物 5 g のメチレンクロライド溶液 100 m l に、四臭化炭素 5. 68 g およびトリフェニルホスフィン 4. 49 g を加え、室温で一晩撹拌した。反応液を氷水にあけ、メチレンクロライドにて抽出した。有機層を洗浄、乾燥後、溶媒を留去した。残渣に石油エーテルを加え、不溶物を濾別し、石油エーテル層を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン

= 1 : 20) にて精製し、3-(3-ウンデシルオキシフェニル)プロピルプロマイド 4.6 g を無色油状物質として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (90MHz, CDCl_3) δ :

0.83 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.04-1.53 (16H, m), 1.55-1.86 (2H, m),
2.14 (2H, m, $J=7\text{Hz}$), 2.70 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.34 (2H, t, $J=7\text{Hz}$),
3.90 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.73-6.85 (3H, m), 7.14-7.42 (1H, m)

IR : 2925, 2553, 1583, 1451, 1261 cm^{-1}

(3) 無水エタノール 40 ml に氷冷下、ナトリウム 0.43 g を加え、窒素ガス気流下、室温で 30 分間攪拌し、ナトリウムエトキシドのエタノール溶液 19 mmol を調製した。この溶液に 2-アセトアミドマロン酸ジエチル 4.0 g を加え、窒素気流下で 30 分間、50℃で加熱した後、室温で上記(2)の化合物 4.6 g を加え、6 時間加熱還流した。室温まで冷却後、希塩酸で中和し、エタノールを留去した後、残渣を酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を洗浄、乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 5 ~ 1 : 1) にて精製し、2-アセトアミド-2-[3-(3-ウンデシルオキシフェニル)プロピル]マロン酸ジエチル 4.2 g を白色結晶として得た。

融点 = 38 ~ 39℃

$^1\text{H-NMR}$ (90MHz, CDCl_3) δ :

0.88 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.12-1.90 (27H, m), 2.03 (3H, s),
2.27-2.73 (4H, m), 3.93 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 4.22 (4H, q, $J=7\text{Hz}$),
6.61-6.87 (3H, m), 7.04-7.22 (1H, m)

IR : 3251, 2917, 1741, 1680 cm^{-1}

MS (EI) : 505(M^+)

(4) 水素化アルミニウムリチウム 1.08 g の無水テトラヒドロフラン溶液 50 ml に氷冷下、上記(3)の化合物 3.5 g の無水テトラヒドロフラン溶液 20 ml を滴下し、氷冷下、1 時間攪拌した。過剰の水素化アルミニウムリチウムを分解後、濾別し、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を洗浄、乾燥後、溶媒を

留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル、クロロホルム：メタノール＝9：1）にて精製し、2-アセトアミド-2-〔3-（3-ウンデシルオキシフェニル）プロピル〕-1, 3-プロパンジオール 1.6 g を無色油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (90MHz, CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.05-1.45 (16H, m), 1.45-1.87 (6H, m),
1.99 (3H, s), 2.47-2.70 (2H, m), 3.64 (4H, dd, $J=12\text{Hz}$, 21Hz),
3.82 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 3.79-4.10 (2H, m), 5.89 (1H, br.s),
6.60-6.82 (3H, m), 7.03-7.31 (1H, m)

IR : 3307, 2926, 2857, 1652 cm^{-1}

MS (EI) : 421 [M+1]

実施例 27

2-アセトアミド-2-〔3-（3-ウンデシルオキシフェニル）プロピル〕-1, 3-プロパンジオール 1.4 g をメタノール 50 ml に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 16.6 ml を加えて3時間加熱還流した。氷水にあげ、希塩酸で中和後、溶媒を留去した。残渣にクロロホルムを加えて抽出後、クロロホルム層を洗浄、乾燥し、溶媒を留去し、ジイソプロピルエーテル-ヘキサンで再結晶し、2-アミノ-2-〔3-（3-ウンデシルオキシフェニル）プロピル〕-1, 3-プロパンジオール 0.9 g を白色結晶として得た。

融点 = $71 \sim 72^\circ\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$ (90MHz, CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.14-1.91 (22H, m), 2.20 (4H, br.s),
2.60 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 3.49 (4H, dd, $J=10\text{Hz}$, 13Hz),
3.94 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 6.62-6.86 (3H, m), 7.05-7.21 (1H, m)

IR : 3344, 3289, 3179, 2919, 1610 cm^{-1}

MS (EI) : 379(M⁺)

実施例 28 : 2-アミノ-2-〔2-（4-オクチルフェニル）エチル〕-1, 3-プロパンジオール

(1) 2-(4-オクタノイルフェニル)エチル アセテート

ジクロロエタン (500 ml) に、窒素気流下、塩化アルミニウム (111.8 g) を加え、室温で攪拌した。次にフェチネルアセテート (91.8 g) およびデカノイルクロリド (100 g) を氷冷下滴下し、室温で一晩攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテルにて抽出した。エーテル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 20) にて精製すると、標記化合物 (61.3 g、収率 38%) を油状物として得た。

IR ν Neat max : 2929, 1740, 1685, 1236 cm^{-1}

(2) 2-(4-オクチルフェニル)エチル アセテート

上記化合物 (24.9 g) のトリフルオロ酢酸溶液 (86 ml) に、氷冷下、トリエチルシラン (28.8 ml) を加え、室温にて2時間攪拌した。溶媒留去し、氷水を注ぎ、冷飽和重炭酸ナトリウム溶液を徐々に加えた。酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 20) にて精製することによって、標記化合物 (20.5 g、収率 87%) を油状物として得た。

IR ν Neat max : 2927, 2855, 1742, 1237 cm^{-1}

(3) 2-(4-オクチルフェニル)エチル アルコール

上記化合物 (30.3 g) のメタノール (300 ml) 溶液に、ナトリウムメトキシド (11.9 g) を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水を注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を5% HCl 水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 15, 酢酸エチル) にて精製すると、標記化合物 (25.0 g、収率 97%) を油状物として得た。

IR ν Neat max : 3357, 2927, 2855, 1467 cm^{-1}

(4) 2-(4-オクチルフェニル)エチル メタンсульフォネート

上記化合物 (25 g) のジクロロメタン溶液 (500 ml) に、トリエチルアミン (16.4 ml) を加え、氷冷した。これにメタンсульホニルクロリド (13.4 g) を滴下し、室温にて1時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 19) にて精製すると、標記化合物 (31.6 g、収率95%) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.13 - 1.79 (12H, m), 2.58 (2H, t, $J=6\text{Hz}$),
2.82 (3H, s), 3.01 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.39 (2H, t, $J=6\text{Hz}$),
7.12 (4H, s)

IR ν Neat max : 2926, 1356, 1174 cm^{-1}

(5) 2-(4-オクチルフェニル)エチル ヨーダイド

上記化合物 (31.5 g) の2-ブタノン溶液 (500 ml) に、ヨウ化ナトリウム (18.13 g) を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 20) にて精製すると、標記化合物 (27.5 g、収率80%) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.07 - 1.79 (12H, m), 2.58 (2H, t, $J=6\text{Hz}$),
3.01 - 3.57 (4H, m), 7.11 (4H, s)

IR ν Neat max : 2925, 2853, 1168 cm^{-1}

(6) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-オクチルフェニル)エチル マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル (26 g) に窒素気流下、ナトリウムエトキシド (8.2 g) の無水エタノール溶液 (80 ml) を滴下し、65°Cで30分間

攪拌した。次に、上記化合物 (13.8 g) の無水テトラヒドロフラン溶液を滴下し、65℃で3時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=1:3) にて精製すると、標記化合物 (10.6 g、収率61%) を得た。

融点 = 49 ~ 51℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.14 (6H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.20 - 1.73 (12H, m),

2.95 (3H, s), 2.30 - 2.83 (6H, m), 4.21 (4H, q, $J=6\text{Hz}$),

6.74 (1H, s), 7.05 (4H, s)

IR ν_{max} : 3257, 2924, 1747, 1643 cm^{-1}

(7) 2-アミノ-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール

(a) リチウムアルミニウムヒドリド (3.03 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (260 ml) に、窒素気流下、上記化合物 (11.55 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (100 ml) を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え、生成した水酸化アルミニウムを濾別後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣にピリジン (40 ml) を加えた。氷冷下、無水酢酸 (30 ml) を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=2:1) にて精製し、1,3-プロパンジイル-2-アセトアミド-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル] イリデンジアセテート (8.25 g) を白色結晶として得た。

(b) 上記ジアセテート (8.25 g) のメタノール溶液 (100 ml) に水酸化リチウム (7.2 g) の水溶液 (100 ml) を加え、2時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、酢酸エチルにて再結晶することにより、融点

103~105℃の標記化合物(4g)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO) δ :

0.86 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.10 - 1.85 (14H, m), 2.38 - 2.79 (6H, m),
3.39 (4H, s), 7.06 (4H, s), 7.84 (2H, brs)

IR ν : 3354, 2925, 1019 cm^{-1}

実施例29 : 2-アミノ-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1,
3-プロパンジオール塩酸塩

2-アミノ-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール(7g)を、エタノール(50ml)に溶かし、1N塩酸/エーテル溶液(50ml)を加えた。溶媒を留去し、析出する結晶をエタノールにて再結晶することによって、標記化合物(4.2g)を得た。

融点 = 118~120℃

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO) δ :

0.89 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.07 - 1.77 (12H, m), 1.82 - 2.17 (2H, m),
2.42 - 2.95 (4H, m), 3.80 (4H, s), 5.03 (2H, brs), 7.11 (4H, s),
8.07 (3H, brs)

IR ν : 3371, 3265, 2924, 1069 cm^{-1}

実施例30 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

水素化リチウムアルミニウム(3.0g)の無水テトラヒドロフラン溶液(260ml)に氷冷下、ジエチル 2-アセトアミド-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル] マロナート(11.55g)の無水テトラヒドロフラン溶液(100ml)を滴下した。氷冷下で1時間攪拌したのち、室温で2時間攪拌した。氷冷下、飽和硫酸ナトリウム水溶液を滴下し、水素化リチウムアルミニウムを分解後、濾別し、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を洗浄、乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(クロロホルム/メタノール=9/1)にて精製し、融点66~68℃の2-アセトアミド-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオールの結晶を得た。このもの

をピリジン (40 ml) に溶かし、氷冷下、無水酢酸 (30 ml) を加え、室温で一晩放置した。反応液を 10% 塩酸水溶液 (500 ml) に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を炭酸水素カリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (酢酸エチル/ヘキサン = 2/1) にて精製し、表題化合物 (8.25 g) を得た。

収率 71%

融点 = 105 ~ 107 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t), 1.22 - 1.29 (10H, m), 1.51 - 1.61 (2H, m),

1.93 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.17 (2H, t), 2.54 (2H, t),

2.55 (2H, t), 4.35 (4H, s), 5.61 (1H, brs), 7.07 (4H, s)

I R (Nujol) ν : 3310, 2920, 1738, 1652, 1556 cm^{-1}

上記実施例と同様にして、以下の化合物が製造される。

実施例 31 : 2-アミノ-2-ヘキシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

R f 値 : 0.47 (CHCl_3 :MeOH: CH_3COOH : H_2O = 70:20:6:4)

I R (KBr) : 3950, 1560, 1420, 1050 cm^{-1}

実施例 32 : 2-アミノ-2-オクチル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

R f 値 : 0.48 (CHCl_3 :MeOH: CH_3COOH : H_2O = 70:20:6:4)

I R (KBr) : 3190, 2930, 2850, 1630, 1560, 1410, 1100, 1060, 1020
 cm^{-1}

実施例 33 : 2-アミノ-2-デシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

R f 値 : 0.49 (CHCl_3 :MeOH: CH_3COOH : H_2O = 70:20:6:4)

I R (KBr) : 3350, 2920, 2850, 1560, 1470, 1420, 1060 cm^{-1}

実施例 34 : 2-アミノ-2-ドデシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

I R (KBr) : 3260, 3050, 2920, 2850, 1590, 1520, 1470, 1260, 1070,
1050 cm^{-1}

融点 = 94.0 ~ 95.5 °C

実施例 35 : 2-アミノ-2-トリデシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

I R (KBr) : 3420, 3320, 2400, 2350, 1620, 1590, 1510, 1465, 1085,
1045, 1030, 1000 cm^{-1}

融点 = 103.0 ~ 104.0 $^{\circ}\text{C}$

実施例 36 : 2-アミノ-2-ペンタデシル-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

I R (KBr) : 3430, 3350, 3030, 2920, 2850, 1620, 1590, 1510, 1475,
1080, 1055, 1040 cm^{-1}

元素分析 計算値 C:63.97, H:11.93, N:4.14, O:9.47, Cl:10.49

分析値 C:63.91, H:11.96, N:4.17, O:9.45, Cl:10.51

融点 = 106.5 ~ 108.0 $^{\circ}\text{C}$

実施例 37 : 2-アミノ-2-(2-ペンタデシニル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

I R (KBr) : 3400, 2920, 2850, 1500, 1470, 1060 cm^{-1}

元素分析 計算値 C:64.74, H:10.87, N:4.19, O:9.58, Cl:10.62

分析値 C:64.34, H:10.95, N:4.13, O:9.57, Cl:10.66

融点 = 100.0 ~ 101.0 $^{\circ}\text{C}$

本化合物は次の工程(1)~(6)のようにして製造される。

(1) 水素化ナトリウム 2.256 g と乾燥ジメチルホルムアミド 30 ml の混合液に氷冷、窒素雰囲気下、プロパルギルアルコール 3.00 g を少量ずつ加えた。室温にて 30 分攪拌したのち、再び氷冷し、クロロメチルメチルエーテル 5.175 g を少量ずつ加えた。さらに室温で一夜攪拌し、氷冷下水素化ナトリウム 4.284 g を加えた後、室温にもどして 30 分攪拌した。再び反応液を氷冷し、臭化ラウリル 26.68 g を乾燥ジメチルホルムアミド 20 ml に溶解した溶液を少量ずつ加えた。さらに室温で一夜攪拌した。反応液を氷水に注いで酢酸エチルで 3 回抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、15-メトキシメトキシ-13-ペンタデシン 12.374 g を得た。

I R (cm^{-1}) : 2940, 2850, 1470, 1150, 1005, 1400, 1000, 930

^1H -NMR (CDCl_3) δ :

0.879 (3H, t, $J=6.74\text{Hz}$, CH_2CH_3), 1.257 (20H, br. s, $\text{CH}_2 \times 10$),

2.213 (2H, tt, $J=6.96$, 2.20Hz , $\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2$),

3.380 (3H, s, OCH_3), 4.204 (2H, t, $J=2.20\text{Hz}$, $\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{C}$),

4.711 (2H, s, OCH_2O)

(2) 上記(1)の化合物 12. 374 g を 1 N 塩酸のメタノール液 230 ml に溶解し、65°C で 1. 5 時間加熱した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、2-ペンタデシニルアルコール 8. 465 g を得た。

融点 = 41. 5 ~ 42. 5°C

I R (cm^{-1}) : 3300, 3200, 2960, 2930, 2850, 1480, 1030

^1H -NMR (CDCl_3) δ :

0.880 (3H, t, $J=6.47\text{Hz}$, CH_3), 1.260 (20H, br. s, $\text{CH}_2 \times 10$),

2.209 (2H, tt, $J=6.96\text{Hz}$, 2.12Hz , $\text{C}\equiv\text{CCH}_2$),

4.255 (2H, dd, $J=2.69$, 2.44Hz , OCH_2)

(3) 塩化カルシウム管を装着した反応容器中で、上記(2)の化合物 8. 465 g をジクロロメタン 85 ml に溶解し、氷冷下四臭化炭素 15. 683 g とトリフェニルホスフィン 14. 867 g を加え、0°C で 5 分間攪拌した。反応液を減圧下で濃縮し、残渣をヘキサンで抽出し、得られたヘキサン抽出液を減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、臭化 2-ペンタデシニルを 7. 964 g 得た。

I R (cm^{-1}) : 2930, 2850, 1470, 1420

^1H -NMR (CDCl_3) δ :

0.880 (3H, t, $J=6.43\text{Hz}$, CH_3), 1.261 (20H, br. s, $\text{CH}_2 \times 10$),

2.232 (2H, tt, $J=6.96\text{Hz}$, 2.36Hz , $\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2$),

3.932 (2H, t, $J=2.32\text{Hz}$, $\text{BrCH}_2\text{C}\equiv\text{C}$)

(4) アセトアミドマロン酸ジエチル 3. 327 g とナトリウムエチラート 1. 1

3.7 gを乾燥エタノール50 mlに溶解し、窒素雰囲気下、室温で30分攪拌した。乾燥エタノール30 mlに上記(3)の化合物4.000 gを溶解した溶液を加え、15時間還流した。反応混合物にメタノール50 mlを加え、不溶物を除去した後、減圧下に溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、2-アセトアミド-2-(2-ペンタデシニル)マロン酸ジエチル3.236 gを得た。

融点 = 43.0 ~ 43.5 °C

I R (cm⁻¹) : 3250, 2920, 2850, 1750, 1650, 1540, 1470, 1380, 1300,
1240, 1200, 1100, 1080, 1060, 1020, 865

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

0.879 (3H, t, J=6.35Hz, CH₃), 1.261 (20H, s, CH₂×10),

1.261 (6H, t, J=7.21Hz, OCH₂CH₃), 2.057 (3H, s, Ac),

2.123 - 2.077 (2H, m, C≡CCH₂CH₂),

3.211 (2H, t, J=2.32Hz, CCH₂-C≡C),

4.253 (2H, q, J=7.08Hz, OCH₂CH₃),

4.257 (2H, q, J=7.08Hz, OCH₂CH₃), 6.896 (1H, br. s, NH)

(5) 塩化カルシウム管を装着した反応容器に2-アセトアミド-2-(2-ペンタデシニル)マロン酸ジエチル2.437 gを乾燥テトラヒドロフラン80 mlに溶解し、氷冷下、水素化アルミニウムリチウム0.898 gを加えた後、室温にもどして30分攪拌した。氷冷下、水3 mlを加え、反応を停止し、減圧下に溶媒を留去した。残渣にピリジン70 ml、無水酢酸130 mlを加え、室温で一夜攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出し、酢酸エチル層を1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーおよびヘキサンから再結晶して精製し、2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(2-ペンタデシニル)プロパン808 mgを得た。

融点 = 95.5 ~ 96.5 °C

I R (cm⁻¹) : 3300, 2930, 2850, 1740, 1650, 1580, 1400, 1380, 1260,

1040

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :0.879 (3H, t, $J=6.47\text{Hz}$, CH_3), 1.255 (24H, br.s, $\text{CH}_2 \times 12$),1.980 (3H, s, NAc), 2.089 (6H, s, OAc $\times 2$),2.140 (2H, m, $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2$),2.790 (2H, t, $J=2.32\text{Hz}$, $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2$),4.422 (4H, s, $\text{CH}_2\text{O} \times 2$), 5.829 (1H, br.s, NH)

(6) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(2-ペンタデシニル)プロパン 600mg をメタノール 28ml に溶解し、1N-水酸化ナトリウム水溶液を 7.09ml 加えて 6 時間還流した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣を溶媒 (メタノール:水=3:7) 20ml に溶解し、Sep-Pak に吸着後、メタノール:水=8:2 で溶出し、溶出液を濃縮した。残渣をメタノールに溶解し、塩酸酸性とした後、減圧下に溶媒を留去し、2-アミノ-2-(2-ペンタデシニル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩 343mg を得た。

実施例 38 : 2-アミノ-2-(12-ヒドロキシドデシル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

IR (KBr): 3350, 2920, 2850, 1500, 1470, 1080, 1050, 1040 cm^{-1} 融点 = 138.0 ~ 142.0 $^{\circ}\text{C}$

本化合物は次の(1)~(5)の工程により製造される。

(1) ドデカンジオール 23.000g を乾燥テトラヒドロフラン 230ml およびジクロロメタン 40ml に溶解し、p-トルエンスルホン酸 10mg およびジヒドロピラン 9.578g を加えた後、室温で一日攪拌した。トリエチルアミン 1.0ml を加えて反応を停止し、反応混合物を減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ドデカンジオールモノテトラヒドロピラニルエーテル 8.132g を得た。

IR (cm^{-1}): 3620, 3450, 2930, 2850, 1460, 1360, 1140, 1125, 1080,

1030

(2) 上記ドデカンジオールモノテトラヒドロピラニルエーテル 7.882g と四

臭化炭素 11.437 g をジクロロメタン 7.8 ml に溶解し、氷冷下トリフェニルホスフィン 10.843 g を加えて 0 °C で 5 分攪拌した。減圧下に溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製して、1-ブロモ-12-テトラヒドロピラニルオキシドデカン を 4.029 g 得た。

I R (cm⁻¹) : 2930, 2850, 1460, 1445, 1360, 1140, 1120, 1080, 1020,
980

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.274 (16H, br.s), 1.611 - 1.554 (6H, m), 1.750 - 1.689 (1H, m),
1.888 - 1.802 (1H, m), 1.852 (2H, qui, J=7.1Hz),
3.381 (1H, dt, J=9.5, 6.9Hz), 3.407 (2H, t, J=6.9Hz),
3.526 - 3.472 (1H, m), 3.728 (1H, dt, J=9.5, 7.0Hz),
3.900 - 3.845 (1H, m), 4.574 (1H, dd, J=4.4, 2.7Hz)

(3) アセトアミドマロン酸ジエチル 6.996 g とナトリウムエトキシド 3.189 g を乾燥エタノール 130 ml に溶解し、これに 1-ブロモ-12-テトラヒドロピラニルオキシドデカン 10.698 g の乾燥エタノール 200 ml 溶液を加えた後、8 時間加熱還流した。減圧下に溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、2-アセトアミド-2-(12-テトラヒドロピラニルオキシドデシル) マロン酸ジエチル 5.837 g を得た。

I R (cm⁻¹) : 3450, 2930, 2850, 1740, 1680, 1500, 1380, 1285, 1020

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.25 (6H, t, J=7.1Hz), 1.25 (20H, br.s), 1.61 - 1.52 (6H, m),
1.83 - 1.71 (2H, m), 2.03 (3H, s), 3.87 - 3.35 (4H, m),
4.24 (4H, q, J=7.1Hz), 4.58 (1H, d.d, J=4.4, 2.4Hz),
6.77 (1H, br.s)

(4) 2-アセトアミド-2-(12-テトラヒドロピラニルオキシドデシル) マロン酸ジエチル 5.837 g をメタノール 13.0 ml に溶解し、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム 2.202 g を徐々に加えた。水素化ナトリウムの全量を加えた後、室温で 2 時間放置した。メタノール 30 ml を加え、2N-塩酸で弱酸

性とした後、減圧下に溶媒を留去した。濃縮残渣にピリジン 100 ml、無水酢酸 200 ml を加え、室温で一昼夜攪拌した。反応溶液を氷水に注いで酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を 1 N 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。濃縮残渣をメタノール 100 ml に溶解し、p-トルエンスルホン酸 30 mg を加えて室温で 1 時間攪拌した。トリエチルアミン 0.5 ml を加え、10 分攪拌した後、減圧下に濃縮した。濃縮残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(12-ヒドロキシドデシル) プロパン 1.180 g を得た。

融点 = 75.0 ~ 76.5 °C

IR (cm⁻¹) : 3350, 2930, 2850, 1740, 1630, 1550, 1375, 1270, 1240, 1040

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.236 (22H, br.s, CH₂ × 11), 1.843 - 1.821 (2H, m, CH₂),

1.937 (3H, s, NAc), 2.056 (6H, s, OAc × 2),

3.608 (2H, br.s, CH₂OH),

4.269 (4H, d.d, J=14.0, 11.5 Hz, CH₂OAc × 2),

5.607 (1H, br.s, NH)

(5) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(12-ヒドロキシドデシル) プロパン 500 mg をメタノール 24 ml に溶解し、1 N-水酸化ナトリウム水溶液 6.0 ml を加え、6 時間加熱還流した。減圧下に濃縮し、メタノールを留去した後、残渣を酢酸エチルで抽出し、水洗後無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下に溶媒を留去し、残渣をメタノールに溶解し、塩酸酸性とした後、再び減圧下に溶媒を濃縮留去し、残渣を真空乾燥して、2-アミノ-2-(12-ヒドロキシドデシル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩 103 mg を得た。

¹H-NMR (DMSO) δ :

1.23 (22H, s, CH₂ × 11), 3.49 - 3.40 (6H, m, CH₂O × 3),

5.26 (3H, br.s, OH × 3)

元素分析 計算値 C:56.94, H:10.99, N:4.43, O:16.43, Cl:11.21

分析値 C:56.73, H:10.95, N:4.32, O:16.49, Cl:11.51

実施例 39 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-ヘキシルプロパン

融点 = 55 ~ 56 °C

実施例 40 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-オクチルプロパン

融点 = 79.5 ~ 82 °C

実施例 41 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-デシルプロパン

融点 = 70 ~ 72 °C

実施例 42 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-ドデシルプロパン

融点 = 75.5 ~ 76.5 °C

実施例 43 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-トリデシルプロパン

融点 = 77.0 ~ 78.0 °C

実施例 44 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-ペンタデシルプロパン

融点 = 82.0 ~ 83.0 °C

実施例 45 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(2-ペンタデシル)プロパン

I R (KBr): 3300, 2930, 2850, 1740, 1650, 1580, 1400, 1380, 1260,
1040 cm^{-1}

融点 = 95.5 ~ 96.5 °C

実施例 46 : 2-アミノ-2-テトラデシル-1, 3-プロパンジオール

I R (KBr): 3300, 3260, 3200, 2930, 2860, 1580, 1480, 1070, 1005
 cm^{-1}

融点 = 68.5 ~ 69.5 °C

実施例 47 : 2-(N-エチルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール

I R (KBr): 3360(br), 2920, 2850, 1470, 1070 cm^{-1}

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

3.530 (2H, d, $J=11.4\text{Hz}$), 3.472 (2H, d, $J=11.4\text{Hz}$),

2.545 (2H, q, $J=7.2\text{Hz}$), 2.5 (2H, br.s), 1.252 (34H, m),

1.121 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 0.879 (3H, t, $J=6.6\text{Hz}$)

融点 = 65.0 ~ 67.0 $^{\circ}\text{C}$

実施例 48 : 2-(N, N-ジメチルアミノ)-2-テトラデシル-1, 3-プロパンジオール

IR (KBr) : 3530, 3050(br), 2920, 2850, 1470, 1060, 1040, 1030 cm^{-1}

融点 = 51 ~ 52 $^{\circ}\text{C}$

実施例 49 : 2-アミノ-2-(4-テトラデセニル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

本化合物は以下(1)~(6)のようにして製造される。

(1) アセトアミドマロン酸ジエチル 6.0 g を脱水エタノール 50 ml に溶解し、ナトリウムエトキシド 2.26 g および 5-ブロモ-1-ペンテン 5.22 g を加え、窒素雰囲気下、一夜還流した。反応液を中和後濃縮し、さらにヘキサノ-酢酸エチル (5 : 1 \rightarrow 2 : 1) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、無色油状物の 2-アセトアミド-2-ペンテニルマロン酸ジエチル 4.871 g を得た。

IR ν_{max} (CHCl_3) : 3450, 3000, 2950, 1740, 1680, 1500, 1480, 1280, 1200, 1100, 1020, 920, 860 cm^{-1}

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

1.25 (2H, m), 1.255 (6H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.044 (2H, m),

2.040 (3H, s), 2.336 (2H, m), 4.246 (4H, q, $J=7.2\text{Hz}$),

4.990 (1H, dd, $J=1.8, 17.2\text{Hz}$), 5.013 (1H, dd, $J=1.8, 10.6\text{Hz}$),

5.758 (1H, ddt, $J=6.2, 10.6, 17.2\text{Hz}$), 6.789 (1H, s)

(2) 2-アセトアミド-2-ペンテニルマロン酸ジエチル 4.0 g をアセトン 210 ml に溶解し、N-メチルモルホリン-N-オキシド 3.3 g および 1% 四酸化オスミウム水溶液 36 ml を加え、室温で 2 時間攪拌した。これに亜硫酸ナ

トリウム 700 mg / 水 20 ml 溶液を加え、15分攪拌した。反応液を濃縮し、クロロホルム / メタノール (10 : 1) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、Rf 値 : 0.3 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) の留分を濃縮した。残渣を 1, 4-ジオキサン 630 ml に溶解し、0.2 M メタ過ヨウ素酸ナトリウム水溶液 70 ml を加え、室温で2時間攪拌した。反応液を濾別後、濃縮し、酢酸エチルで抽出し、さらに水洗した。ヘキサン層を脱水後、濃縮し、無色油状物の 2-アセトアミド-2-(4-ホルミルブチル) マロン酸ジエチル 4.17 g を得た。

Rf 値 = 0.4 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1)

(3) 臭化デカン 7.0 g およびトリフェニルホスフィン 10 g を窒素雰囲気下 120°C で8時間攪拌した。アセトン-エーテルにより再結晶し、無色結晶の臭化デシルトリフェニルホスホニウム 14.4 g を得た。

IR ν_{\max} (CHCl₃) : 2920, 2850, 1440, 1120, 1000, 680 cm⁻¹

(4) 臭化デシルトリフェニルホスホニウム 10.85 g を乾燥テトラヒドロフラン 100 ml に溶解し、アルゴン雰囲気下、1.6 M n-ブチルリチウム / ヘキサン溶液 13 ml を滴下し、15分攪拌した。-78°C に冷却し、2-アセトアミド-2-(4-ホルミルブチル) マロン酸ジエチル 4.17 g / 乾燥テトラヒドロフラン 50 ml 溶液を滴下し、-78°C、アルゴン雰囲気下、40分攪拌した。同条件下で、t-ブタノール 3.3 ml / 乾燥テトラヒドロフラン 15 ml 溶液を滴下し、室温、アルゴン雰囲気下、1.5時間攪拌した。反応液をエーテルで希釈し、水洗した後、有機層を脱水後、濃縮した。さらに、ヘキサン-酢酸 (5 : 1 → 5 : 2) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色油状物の 2-アセトアミド-2-(4-テトラデセニル) マロン酸ジエチル 2.1 g を得た。

IR ν_{\max} (CHCl₃) : 3450, 2940, 2850, 1740, 1680, 1500, 1380, 1280, 1200, 1100, 1020, 860 cm⁻¹

¹H-NMR (CDCl₃ / TMS) δ :

0.88 (3H, t, J=6.6Hz), 1.257 (16H, m), 1.255 (6H, t, J=7.08Hz),

2.010 (4H, m), 2.066 (3H, s), 2.334 (2H, m),
 4.243 (4H, q, $J=7.08\text{Hz}$), 5.273 (1H, dt, $J=5.4, 10.8\text{Hz}$),
 5.376 (1H, dt, $J=5.4, 10.8\text{Hz}$), 6.775 (1H, s)

(5) 2-アセトアミド-2-(4-テトラデセニル)マロン酸ジエチル 807 mg を乾燥テトラヒドロフラン 25 ml に溶解し、氷冷下、水素化アルミニウムリチウム 297 mg を加え、室温で 1.5 時間攪拌した。これに、水 0.544 ml を氷冷下に加え、室温で 30 分攪拌した。反応液を濃縮し、残渣にピリジン-無水酢酸適量を加え、一夜、室温で攪拌した。反応液を氷中に注加し、酢酸エチルで抽出し、1 N 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄した。酢酸エチル層を脱水後、濃縮し、さらにヘキサン-酢酸エチル (3:1→2:1) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、無色粉末の 2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(4-テトラデセニル)プロパン 537 mg を得た。

IR ν_{max} (CHCl_3): 3430, 2920, 2850, 1740, 1680, 1500, 1370, 1280,
 1180, 1090, 1010, 855 cm^{-1}

(6) 2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(4-テトラデセニル)プロパン 450 mg をメタノール 27 ml に溶解し、1 N 水酸化ナトリウム水溶液 9 ml を加え、窒素雰囲気下、8 時間還流した。反応液を塩酸で中和後、濃縮し、水を加え、Sep-Pak (C_{18}) (商品名) に付し、メタノールで溶出した。メタノール溶出液を濃縮し、淡黄色油状物の 2-アミノ-2-(4-テトラデセニル)1,3-プロパンジオール塩酸塩 332 mg を得た。

IR ν_{max} (KBr): 3400(br), 2920, 2850, 1590, 1500, 1470, 1050,
 1040 cm^{-1}

Rf 値: 0.6 (クロロホルム:メタノール:酢酸:水=70:20:6:4)
 実施例 50: 2-アミノ-1,3-ジアセトキシ-2-オクタデシルプロパン

IR (CHCl_3): 3400(br), 2930, 2850, 1740, 1470, 1380, 1240, 1040
 cm^{-1}

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

4.014 (2H, d, $J=11.0\text{Hz}$), 3.938 (2H, d, $J=11.0\text{Hz}$),

2.089 (6H, s), 1.255 (34H, m), 0.879 (3H, t, $J=6.6\text{Hz}$)

本化合物は次のようにして調製される。

(1) 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール塩酸塩 7 g を N, N-ジメチルホルムアミド 150 ml に懸濁し、トリエチルアミン 3.8 g およびジ-*t*-ブチルジカーボネート 5.4 g を加え、50°C で 5 時間攪拌した。氷冷下、反応液に水を加え、攪拌した後、生じた沈殿を減圧濾過により濾取した。この沈殿をヘキサン-酢酸エチル (5 : 1) で再結晶し、無色結晶の 2-オクタデシル-2-(*N*-*t*-ブトキシカルボニルアミノ)-1, 3-プロパンジオール 6.79 g を得た。

I R ν_{max} (KBr) : 3400(br), 3300, 2920, 2850, 1680, 1560, 1300,
1180, 1020 cm^{-1}

(2) 上記(1)の化合物 4 g をピリジン 15 ml および無水酢酸 50 ml に溶解し、室温で一晩攪拌した。反応液を氷水中に注加し、酢酸エチルで抽出、1 N 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄した。脱水後、濃縮し、無色油状物の 1, 3-ジアセトキシー-2-(*N*-*t*-ブトキシカルボニルアミノ)プロパン 4.8 g を得た。

I R ν_{max} (CHCl_3) : 3460, 2930, 2850, 1740, 1690(sh), 1510, 1470,
1380, 1240, 1160, 1040 cm^{-1}

(3) 上記(2)の化合物 4.8 g をトリフルオロ酢酸 10 ml に溶解し、室温で 15 分放置した。これを酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウムにより洗浄した。酢酸エチル層を脱水後、濃縮し、無色油状物の 2-アミノ-1, 3-ジアセトキシー-2-オクタデシルプロパン 3.83 g を得た。

実施例 51 : 1, 3-ジアセトキシー-2-オクタデシル-2-(*N*-ペンタノイルアミノ)プロパン

I R (CHCl_3) : 3450, 3400, 2920, 2850, 1740, 1680, 1520, 1460, 1380,
1240, 1020 cm^{-1}

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

5.599 (1H, s), 4.330 (2H, d, $J=11.6\text{Hz}$), 4.271 (2H, d, $J=11.6\text{Hz}$),

2.150 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.078 (6H, s), 1.6 (4H, m),

1.251 (34H, m), 0.918 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 0.879 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$)

実施例 52 : 2-オクタデシル-2-(N-ペンタノイルアミノ)-1, 3-プロパンジオール

I R (KBr) : 3420, 3350(br), 2920, 2850, 1650, 1520, 1460, 1030 cm^{-1}

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

5.840 (1H, s), 4.021 (2H, br.s), 3.803 (2H, d, $J=11.4\text{Hz}$),

3.559 (2H, t, $J=11.4\text{Hz}$), 2.231 (2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 1.6 (4H, m),

1.251 (34H, m), 0.928 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 0.878 (3H, t, $J=6.6\text{Hz}$)

融点 = 73.0 ~ 73.5 $^{\circ}\text{C}$

上記化合物は、次のようにして製造される。

(1) 2-アミノ-1, 3-ジアセトキシ-2-オクタデシルプロパン 1.0 g を乾燥エーテル 50 ml に溶解し、N, N-ジメチルアニリン 425 mg および塩化ペンタノイル 500 mg を加え、窒素雰囲気下、室温で 6 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、1 N 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄した。有機層を脱水後、濃縮し、さらに、ヘキサン-酢酸エチル (5 : 1 \rightarrow 2 : 1) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色油状物の 1, 3-ジアセトキシ-2-オクタデシル-2-(N-ペンタノイルアミノ) プロパン 1.036 g を得た。

I R ν_{max} (CHCl_3) : 3450, 3400, 2920, 2850, 1740, 1680, 1520, 1460, 1380, 1240, 1020 cm^{-1}

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.879 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 0.918 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 1.251 (34H, m),

1.6 (4H, m), 2.078 (6H, s), 2.150 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$),

4.271 (2H, d, $J=11.6\text{Hz}$), 4.330 (2H, d, $J=11.6\text{Hz}$), 5.599 (1H, s)

(2) 1, 3-ジアセトキシ-2-オクタデシル-2-(N-ペンタノイルアミノ)

プロパン 400 mg をメタノール 8 ml に溶解し、28% ナトリウムメトキシド-メタノール溶液 17 mg を加え、室温で1時間攪拌した。濃塩酸-メタノール (1:11) 0.088 ml を加えてから濃縮し、さらにクロロホルム-メタノール (30:1) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した。クロロホルム-ヘキサンにて再結晶し、無色結晶の2-オクタデシル-2-(N-ペンタノイルアミノ)-1,3-プロパンジオール 312 mg を得た。

実施例 53 : 2-オクタデシル-2-(N-ペンチルアミノ)-1,3-プロパンジオール

I R (KBr): 3470(br), 2930, 2850, 1480, 1060 cm^{-1}

^1H -NMR (CDCl_3 /TMS) δ :

3.990 (3H, br.s), 3.707 (2H, d, $J=12.8\text{Hz}$),

3.643 (2H, d, $J=12.8\text{Hz}$), 2.686 (2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 1.252 (40H, m),

0.908 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 0.879 (3H, t, $J=6.6\text{Hz}$)

融点 = 53.0 ~ 54.0 $^{\circ}\text{C}$

本化合物は次のようにして製造される。

1,3-ジアセトキシ-2-オクタデシル-2-(N-ペンタノイルアミノ)プロパン 400 mg を乾燥エーテル 30 ml に溶解し、氷冷下、水素化アルミニウムリチウム 150 mg を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を濃縮し、乾燥テトラヒドロフラン 20 ml を加え、氷冷下、水 0.15 ml、15% 水酸化ナトリウム水溶液 0.15 ml、水 0.45 ml を順次加えた後、反応液を濾過した。濾液を濃縮し、クロロホルム-メタノール-酢酸 (19:1:0.1 \rightarrow 10:1:0.05) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色粉末の2-オクタデシル-2-(N-ペンチルアミノ)-1,3-プロパンジオール 153 mg を得た。

実施例 54 : 2-(N-デカノイルアミノ)-1,3-ジアセトキシ-2-オクタデシルプロパン

^1H -NMR (CDCl_3 /TMS) δ :

5.594 (1H, s), 4.828 (2H, d, $J=12.0\text{Hz}$), 4.269 (2H, d, $J=12.0\text{Hz}$),

2.140 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.6 (2H, m), 1.252 (46H, m),

0.878 (6H, t, $J=6.8\text{Hz}$)

R f 値 : 0.5 (EtOAc: C_6H_{14} = 1:2)

実施例 55 : 2-(N-デカノイルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロ
パンジオール

I R (KBr) : 3350, 3100, 2920, 2850, 1640, 1560, 1480, 1080 cm^{-1}

融点 = 71.5 ~ 72.5 $^{\circ}\text{C}$

実施例 56 : 2-(N-デシルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパ
ンジオール

I R (KBr) : 3350(br), 2920, 2850, 1470, 1060 cm^{-1}

^1H -NMR (CDCl_3 /TMS) δ :

3.562 (2H, d, $J=12.8\text{Hz}$), 3.498 (2H, d, $J=12.8\text{Hz}$),

2.741 (3H, br.s), 2.536 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.525 (2H, m),

1.251 (48H, m), 0.879 (6H, t, $J=6.8\text{Hz}$)

融点 = 48.0 ~ 49.5 $^{\circ}\text{C}$

実施例 57 : 1, 3-ジアセトキシ-2-(N, N-ジメチルアミノ)-2-オ
クタデシルプロパン

^1H -NMR (CDCl_3 /TMS) δ :

4.208 (2H, d, $J=11.4\text{Hz}$), 4.071 (2H, d, $J=11.4\text{Hz}$), 2.359 (6H, s),

2.070 (6H, s), 1.252 (34H, m), 0.878 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$)

R f 値 : 0.4 (EtOAc: C_6H_{14} = 3:2)

実施例 58 : 2-(N, N-ジメチルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プ
ロパンジオール

I R (KBr) : 3540, 3100(br), 2920, 2850, 1470, 1060, 1040 cm^{-1}

^1H -NMR (CDCl_3 /TMS) δ :

3.715 (2H, d, $J=10.8\text{Hz}$), 3.632 (2H, d, $J=10.8\text{Hz}$),

3.040 (2H, br.s), 2.412 (6H, s), 1.253 (34H, m),

0.880 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$)

融点 = 63.5 ~ 64.5 °C

本化合物は次のようにして製造される。

(1) 2-アミノ-1, 3-ジアセトキシ-2-オクタデシルプロパン 700 mg をアセトニトリル 35 ml に溶解し、37%ホルムアルデヒド 1.38 g および水素化シアノホウ素ナトリウム 330 mg を加え、室温で1時間攪拌した。これに酢酸 0.265 ml を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を濃縮し、ヘキサン-酢酸エチル (4:1 → 3:1) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色油状物の 1, 3-ジアセトキシ-2-(N, N-ジメチルアミノ)-2-オクタデシルプロパン 436 mg を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.878 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.252 (34H, m), 2.070 (6H, s),

2.359 (6H, s), 4.071 (2H, d, $J=11.4\text{Hz}$), 4.208 (2H, d, $J=11.4\text{Hz}$)

Rf 値 = 0.4 (酢酸エチル : ヘキサン = 3 : 2)

(2) 上記(1)の化合物 436 mg をメタノール 15 ml に溶解し、28%ナトリウムメトキシドメタノール溶液 37 mg を加え、室温で6時間攪拌した。反応液を濃縮した後、水を加え、生じた沈殿を濾取し、さらに、クロロホルム-ヘキサンにより再結晶し、無色結晶の 2-(N, N-ジメチルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール 295 mg を得た。

実施例 59 : 2-アミノ-2-(cisまたはtrans-4-テトラデセニル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

実施例 60 : 2-アミノ-2-(3-ドデシルチオプロピル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

IR (KBr) : 3510, 3450, 3380, 3020, 2920, 2850, 1630, 1530, 1460, 1070, 1050 cm^{-1}

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 - DMSO-d_6 /TMS) δ :

3.78 (2H, d, $J=11.8\text{Hz}$), 3.68 (2H, d, $J=11.8\text{Hz}$), 2.5 (4H, m),

1.26 (24H, m), 0.88 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$)

融点 = 76 ~ 78 °C

本化合物は以下のようにして製造される。

(1) ドデシルチオール 5 g を乾燥 N, N-ジメチルホルムアミド 50 ml に溶解し、氷冷下、60%水素化ナトリウム 1 g を加え、室温で 1 時間攪拌した。さらに、氷冷下、3-ブロモプロパノール 3.45 g の乾燥 N, N-ジメチルホルムアミド 10 ml 溶液を滴下し、室温で 3 時間攪拌した。反応液を氷中に注加し、エーテル抽出後、1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、エーテル層を脱水後、濃縮した。さらに、ヘキサン-酢酸エチル (10:1→3:1) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、3-ドデシルチオプロパノール 6.071 g を無色粉末として得た。

IR ν_{\max} (CHCl_3): 3450(br), 2930, 2850, 1460, 1050 cm^{-1}

(2) 3-ドデシルチオプロパノール 3.0 g をジクロロメタン 60 ml に溶解し、氷冷下、四臭化炭素 7.66 g、トリフェニルホスフィン 5.44 g を加え、氷冷下、15 分攪拌した。反応液を濃縮し、残渣をヘキサンで抽出後、その抽出液を濃縮した。さらに、ヘキサンを展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、淡黄色油状物の 3-ブロモプロピルドデシルスルフィド 3.255 g を得た。

Rf 値 = 0.4 (ヘキサン)

(3) アセトアミドマロン酸ジエチル 1.6 g を脱水エタノール 30 ml に溶解し、ナトリウムエトキシド 505 mg および 3-ブロモプロピルドデシルスルフィド 2 g を加え、窒素雰囲気下、一夜還流した。反応液を濃塩酸-エタノール (1:1) で中和後、濃縮した。さらに、ヘキサン-酢酸エチル (5:1→5:2) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色粉末の 2-セトアミド-2-(3-ドデシルチオプロピル)マロン酸ジエチル 1.722 g を得た。

IR ν_{\max} (CHCl_3): 3440, 2930, 2850, 1740, 1680, 1500, 1380, 1260, 1100, 1020, 860 cm^{-1}

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS) δ :

0.88 (3H, t, J=7.4Hz), 1.26 (18H, m), 1.26 (6H, t, J=7.3Hz),
 1.57 (4H, m), 2.04 (3H, s), 2.42 (2H, m), 2.47 (2H, t, J=7.3Hz),
 2.48 (2H, t, J=7.3Hz), 4.25 (4H, q, J=7.4Hz), 6.78 (1H, s)

(4) 2-アセトアミド-2-(3-ドデシルチオプロピル)マロン酸ジエチル 1.5 gを乾燥テトラヒドロフラン 30 mlに溶解し、氷冷下、水素化アルミニウムリチウム 500 mgを加え、氷冷下、30分攪拌後、室温で1時間攪拌した。反応液に氷冷下、水 1.0 mlを加え、1時間攪拌した後、濃縮した。残渣にピリジン 5 mlおよび無水酢酸 10 mlを加え、室温で一夜攪拌した。反応液を氷中に注加し、酢酸エチル抽出した後、1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄した。酢酸エチル層を脱水後、濃縮し、ヘキサン-酢酸エチル (3:1→1:1)を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、さらにヘキサンで再結晶し、2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(3-ドデシルチオプロピル)プロパン 852 mgを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS) δ :

0.88 (3H, t, J=6.8Hz), 1.26 (24H, m), 1.96 (3H, s),
 2.09 (6H, s), 2.5 (4H, m), 4.30 (4H, s), 5.67 (1H, s)

Rf値 = 0.4 (酢酸エチル:ヘキサン = 7:3)

(5) 2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(3-ドデシルチオプロピル)プロパン 750 mgをメタノール 30 mlに溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液 10 mlを加え、窒素雰囲気下、6時間還流した。反応液を氷冷し、生じた沈殿を濾取した。沈殿をメタノールに溶解し、濃塩酸-メタノール (1:11) 3 mlを加え、濃縮した。さらに、酢酸エチル-ヘキサンにて再結晶し、無色結晶の2-アミノ-2-(3-ドデシルチオプロピル)-1,3-プロパンジオール塩酸塩 449 mgを得た。

実施例 61: 2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(3-ドデシルチオプロピル)プロパン

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS) δ :

5.67 (1H, s), 4.30 (4H, s), 2.5 (4H, m), 2.09 (6H, s),

1.96 (3H, s), 1.26 (24H, m), 0.88 (3H, t, J=6.8Hz)

R f 値 : 0.4 (EtOAc: C₆ H₁₄ = 7:3)

実施例 62 : 2-アミノ-2-(3, 7, 11-トリメチルドデシル)-1, 3-
-プロパンジオール塩酸塩

実施例 63 : 2-アミノ-2-(3, 7, 11-トリメチル-2, 6, 10-トリ
リデセニル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

実施例 64 : 2-アミノ-2-(8-オキソテトラデシル)-1, 3-プロパン
ジオール塩酸塩

実施例 65 : 2-アミノ-2-(8-ヒドロキシテトラデシル)-1, 3-プロ
パンジオール塩酸塩

実施例 66 : 2-アミノ-2-(2-ドデシルアミノエチル)-1, 3-プロパ
ンジオール塩酸塩

実施例 67 : 2-アミノ-2-(2-ドデカノイルアミノエチル)-1, 3-プロ
ロパンジオール塩酸塩

実施例 68 : 2-アミノ-2-(11-カルボキシウンデシル)-1, 3-プロ
パンジオール塩酸塩

実施例 69 : 2-アミノ-2-(11-メトキシカルボニルウンデシル)-1,
3-プロパンジオール塩酸塩

実施例 70 : 2-アミノ-2-(12-アセトキシドデシル)-1, 3-プロパ
ンジオール塩酸塩

実施例 71 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(3, 7, 11-
トリメチルドデシル)プロパン

実施例 72 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(3, 7, 11-
トリメチル-2, 6, 10-トリデセニル)プロパン

実施例 73 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(8-オキソテト
ラデシル)プロパン

実施例 74 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(8-ヒドロキシ
テトラデシル)プロパン

- 実施例 75 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(11-メトキシカルボニルウンデシル) プロパン
- 実施例 76 : 2-アミノ-2-(2-プロピニル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 77 : 2-アミノ-2-(2-プロペニル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 78 : 2-(N-メチルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 79 : 2-(N, N-ジメチルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 80 : 2-(N-オクタデシルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 81 : 2-(N, N-ジオクタデシルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 82 : 2-(N-オクタデカノイルアミノ)-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 83 : 2-アミノ-2-デシル-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 84 : 2-アミノ-2-ドデシル-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 85 : 2-アセトアミド-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 86 : 2-アミノ-2-(2-オクタデシニル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 87 : 2-アミノ-2-(2-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 88 : 2-アミノ-2-(4-フェニルブチル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 89 : 2-アミノ-2-(5-フェニルペンチル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 90 : 2-アミノ-2-(2-フェニルプロピル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 91 : 2-アミノ-2-[8-(4-ヘキシルフェニル) オクチル]-1,

3-プロパンジオール

- 実施例 92 : 2-アミノ-2-[4-(4-デシルフェニル)ブチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 93 : 2-アミノ-2-[4-(4-ペンチルオキシフェニル)ブチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 94 : 2-アミノ-2-[4-(4-ブロモフェニル)ブチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 95 : 2-アミノ-2-[3-(2, 4-ジニトロフェニル)プロピル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 96 : 2-アミノ-2-[3-(4-アミノフェニル)プロピル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 97 : 2-アミノ-2-[3-(4-デシルオキシフェニル)-2-プロペニル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 98 : 2-アミノ-2-(14-フルオロテトラデシル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=92~94℃
- 実施例 99 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(14-フルオロテトラデシル)プロパン、融点=82~84℃
- 実施例 100 : 2-アミノ-2-(9-ペンチルオキシノニル)-1, 3-プロパンジオール・1/5水和物、融点=32~33℃
- 実施例 101 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(9-ペンチルオキシノニル)プロパン、融点=62~64℃
- 実施例 102 : 2-アミノ-2-(8-ヘキシルオキシオクチル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=66~67℃
- 実施例 103 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(8-ヘキシルオキシオクチル)プロパン、融点=66~69℃
- 実施例 104 : 2-アミノ-2-(7-ヘプチルオキシヘプチル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=59~61℃
- 実施例 105 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(7-ヘプチル

オキシヘプチル) プロパン、融点 = 53 ~ 55 °C

実施例 106 : 2-アミノ-2-(6-オクチルオキシヘキシル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点 = 58 ~ 62 °C

実施例 107 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(6-オクチルオキシヘキシル) プロパン、融点 = 47 ~ 50 °C

実施例 108 : 2-アミノ-2-(2-フェニルエチル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点 = 156 ~ 157 °C

実施例 109 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(2-フェニルエチル) プロパン、融点 = 116 ~ 117 °C

実施例 110 : 2-アミノ-2-(3-フェニルブチル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩・1/5水和物、融点 = 111 ~ 118 °C

実施例 111 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(3-フェニルブチル) プロパン、融点 = 98 ~ 99 °C

実施例 112 : 2-アミノ-2-(6-フェニルヘキシル)-1, 3-プロパンジオール、融点 = 77 ~ 79 °C

実施例 113 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(6-フェニルヘキシル) プロパン、融点 = 58 ~ 59 °C

実施例 114 : 2-アミノ-2-(10-フェニルデシル)-1, 3-プロパンジオール、融点 = 87 ~ 88.5 °C

実施例 115 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(10-フェニルデシル) プロパン、IR : 3301, 2928, 2855, 1747, 1661, 1552 cm⁻¹

実施例 116 : 2-アミノ-2-[6-(3-フェニルプロピルオキシ)ヘキシル]-1, 3-プロパンジオール・1/4水和物、融点 = 66 ~ 67 °C

実施例 117 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[6-(3-フェニルプロピルオキシ)ヘキシル] プロパン、IR : 3418, 1735, 1655, 1026 cm⁻¹

- 実施例 118 : 2-アミノ-2-[8-(フェニルメチルオキシ)オクチル]-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=87~88℃
- 実施例 119 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[8-(フェニルメチルオキシ)オクチル]プロパン、IR ; 3308, 1740, 1660, 1240 cm⁻¹
- 実施例 120 : 2-アミノ-2-[3-(4-ヘプチルシクロヘキシル)プロピル]-1, 3-プロパンジオール、融点=65~66℃
- 実施例 121 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[3-(4-ヘプチルシクロヘキシル)プロピル]プロパン、融点=53~55℃
- 実施例 122 : 2-アミノ-2-[4-(4-ブチルシクロヘキシル)ブチル]-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩・1/5水和物、融点=96~99℃
- 実施例 123 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[4-(4-ブチルシクロヘキシル)ブチル]プロパン、融点=66~69℃
- 実施例 124 : 2-アミノ-2-(4-ノニルフェニルメチル)-1, 3-プロパンジオール、融点=112~113℃
- 実施例 125 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(4-ノニルフェニルメチル)プロパン、融点=85~89℃
- 実施例 126 : 2-アミノ-2-[3-(4-ヘプチルフェニル)プロピル]-1, 3-プロパンジオール・1/2水和物、融点=78~80℃
- 実施例 127 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[3-(4-ヘプチルフェニル)プロピル]プロパン、融点=62~64℃
- 実施例 128 : 2-アミノ-2-[3-(4-ウンデシルフェニル)プロピル]-1, 3-プロパンジオール、融点=89~91℃
- 実施例 129 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[3-(4-ウンデシルフェニル)プロピル]プロパン、融点=64~67℃
- 実施例 130 : 2-アミノ-2-[4-(4-オクチルフェニル)ブチル]-1,

3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=108~110℃

実施例131: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[4-(4-オクチルフェニル)ブチル]プロパン、融点=64~67℃

実施例132: 2-アミノ-2-[6-(4-ブチルフェニル)ヘキシル]-1, 3-プロパンジオール、融点=70~71℃

実施例133: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[6-(4-ブチルフェニル)ヘキシル]プロパン、IR; 3300, 2930, 2858, 1748, 1660 cm⁻¹

実施例134: 2-アミノ-2-[8-(4-エチルフェニル)オクチル]-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩・1水和物、融点=47~48℃

実施例135: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[8-(4-エチルフェニル)オクチル]プロパン、融点=58~60℃

実施例136: 2-アミノ-2-(4-オクチルオキシフェニルメチル)-1, 3-プロパンジオール、融点=119~120℃

実施例137: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(4-オクチルオキシフェニルメチル)プロパン、融点=77~78℃

実施例138: 2-アミノ-2-(4-デシルオキシフェニルメチル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=100~102℃

実施例139: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(4-デシルオキシフェニルメチル)プロパン、融点=74~77℃

実施例140: 2-アミノ-2-[2-(4-ペンチルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=134~137℃

実施例141: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ペンチルオキシフェニル)エチル]プロパン、融点=93~95℃

実施例142: 2-アミノ-2-[3-(4-ヘキシルオキシフェニル)プロピル]-1, 3-プロパンジオール、融点=70~71℃

実施例143: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[3-(4-ヘキシルオキシフェニル)プロピル]プロパン、融点=70~72℃

5 °C

- 実施例 1 4 4 : 2-アミノ-2-〔3-(4-ヘプチルオキシフェニル)プロピル〕-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩・1/6水和物、融点=111~113 °C
- 実施例 1 4 5 : 2-アセトアミド-2-〔3-(4-ヘプチルオキシフェニル)プロピル〕-1, 3-プロパンジオール、融点=93~95 °C
- 実施例 1 4 6 : 2-アミノ-2-〔3-(4-オクチルオキシフェニル)プロピル〕-1, 3-プロパンジオール、融点=73~75 °C
- 実施例 1 4 7 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-〔3-(4-オクチルオキシフェニル)プロピル〕プロパン、融点=66~69 °C
- 実施例 1 4 8 : 2-アミノ-2-〔4-(4-デシルオキシフェニル)プロピル〕-1, 3-プロパンジオール、融点=60~62 °C
- 実施例 1 4 9 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-〔4-(4-デシルオキシフェニル)プロピル〕プロパン、融点=66~67 °C
- 実施例 1 5 0 : 2-アミノ-2-〔3-(3-ヘプチルオキシフェニル)プロピル〕-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=102~103 °C
- 実施例 1 5 1 : 2-アセトアミド-2-〔3-(3-ヘプチルオキシフェニル)プロピル〕-1, 3-プロパンジオール、IR ; 3305, 2932, 1652, 1376 cm⁻¹
- 実施例 1 5 2 : 2-アミノ-2-〔4-(4-ペンチルオキシフェニル)ブチル〕-1, 3-プロパンジオール、融点=79~80 °C
- 実施例 1 5 3 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-〔4-(4-ペンチルオキシフェニル)ブチル〕プロパン、融点=83~84 °C
- 実施例 1 5 4 : 2-アミノ-2-〔4-(4-ヘキシルオキシフェニル)ブチル〕-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=99~100 °C
- 実施例 1 5 5 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-〔4-(4-ヘ

- キシルオキシフェニル) ブチル} プロパン、融点=83~87℃
- 実施例156: 2-アミノ-2-[5-(4-ブトキシフェニル) ペンチル] -
1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=79~80℃
- 実施例157: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[5-(4-ブ
トキシフェニル) ペンチル] プロパン、融点=71~73℃
- 実施例158: 2-アミノ-2-[8-(4-メトキシフェニル) オクチル] -
1, 3-プロパンジオール、融点=69~70℃
- 実施例159: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[8-(4-メ
トキシフェニル) オクチル] プロパン、IR: 3301, 174
5, 1662, 1246 cm⁻¹
- 実施例160: 2-アミノ-2-[4-(4-クロロフェニル) ブチル] -1,
3-プロパンジオール、融点=75~79℃
- 実施例161: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[4-(4-ク
ロロフェニル) ブチル] プロパン、融点=82~84℃
- 実施例162: 2-アミノ-2-[3-(4-デカノイルアミノフェニル) プロ
ピル] -1, 3-プロパンジオール・1/4水和物、融点=11
2~113℃
- 実施例163: 2-t-ブトキシカルボニルアミノ-2-[3-(4-デカノイ
ルアミノフェニル) プロピル] プロパン、融点=93~94℃
- 実施例164: 2-アミノ-2-[3-(4-デシルアミノフェニル) プロピル]
-1, 3-プロパンジオール・1/2水和物、融点=100~
102℃
- 実施例165: 2-アミノ-2-{7-[2-(4-ヘキシルフェニル) -1,
3-ジオキソラン-2-イル] ヘプチル} -1, 3-プロパンジ
オール・1/2水和物・塩酸塩、IR: 3346, 1610, 1
510, 1047 cm⁻¹
- 実施例166: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-{7-[2-(
4-ヘキシルフェニル) -1, 3-ジオキソラン-2-イル] ヘ

ブチル} プロパン、IR ; 3308, 1745, 1660, 1238, 1043 cm^{-1}

実施例 167 : 2-アミノ-2-〔7-(4-ヘキシルベンゾイル) ヘブチル〕-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=114~115°C

実施例 168 : 2-アミノ-2-〔8-(4-ヘキシルフェニル) オクチル〕-1, 3-プロパンジオール、融点=71~73°C

実施例 169 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-〔8-(4-ヘキシルフェニル) オクチル〕 プロパン、IR ; 3306, 1745, 1660, 1240 cm^{-1}

実施例 170 : 2-アミノ-2-〔3-〔4-(2-デシル-1, 3-ジオキソラン-2-イル) フェニル〕 プロピル〕-1, 3-プロパンジオール・2/3水和物、IR ; 3346, 1037 cm^{-1}

実施例 171 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-〔3-〔4-(2-デシル-1, 3-ジオキソラン-2-イル) フェニル〕 プロピル〕 プロパン、融点=45~47°C

実施例 172 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-〔3-〔4-(2-ヘキシル-1, 3-ジオキソラン-2-イル) フェニル〕 プロピル〕 プロパン・3/5水和物、融点=48~50°C

実施例 173 : 2-アミノ-2-〔3-(4-デカノイルフェニル) プロピル〕-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=126~127°C

実施例 174 : 2-アミノ-2-〔3-(4-ヘプタノイルフェニル) プロピル〕-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩、融点=129~130°C

実施例 175 : 2-アミノ-2-〔2-〔4-(5-フェニルペンチルオキシメチル) フェニル〕 エチル〕-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩・3/2水和物、融点=105~108°C

実施例 176 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-〔2-〔4-(5-フェニルペンチルオキシメチル) フェニル〕 エチル〕 プロパン、IR ; 3308, 1738, 1651, 1226 cm^{-1}

- 実施例 177 : 2-アミノ-2-[6-(4-ヘキシルオキシフェニルオキシ)ヘキシル]-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩・5/4水和物、融点=90~95℃
- 実施例 178 : 2-アセトアミド-2-[6-(4-ヘキシルオキシフェニルオキシ)ヘキシル]-1, 3-プロパンジオール、融点=81~83℃
- 実施例 179 : 2-アミノ-2-[6-(2-フェニルオキシエチルオキシ)ヘキシル]-1, 3-プロパンジオール、融点=90~93℃
- 実施例 180 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[6-(2-フェニルオキシエチルオキシ)ヘキシル]プロパン、IR; 2935, 2864, 1744, 1660, 1245 cm⁻¹
- 実施例 181 : 2-アセトアミド-2-(12-フェニルオキシドデシル)-1, 3-プロパンジオール、融点=76~77℃
- 実施例 182 : 2-アミノ-2-(12-フェニルオキシドデシル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩
- 実施例 183 : 2-(N, N-ジメチルアミノ)-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 184 : 2-アミノ-2-[2-(4-ヘキシルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 185 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ヘキシルオキシフェニル)エチル]プロパン
- 実施例 186 : 2-アミノ-2-{2-[4-(8-フルオロオクチル)フェニル]エチル}-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 187 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-{2-[4-(8-フルオロオクチル)フェニル]エチル}プロパン
- 実施例 188 : 2-アミノ-2-{2-[4-(7-フルオロヘプチルオキシ)フェニル]エチル}-1, 3-プロパンジオール

白色アモルファス様固体

R f 値 = 0.09 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1)

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ ;

1.26-1.64 (14H, m), 3.50 (4H, s), 3.90 (2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 4.42 (2H, td, $J=47.4\text{Hz}$, 6.3Hz), 5.48 (2H, br.s), 6.83 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.09 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.86 (3H, br.s)

IR (KBr) 3391, 1612, 1581, 1249, 831 cm^{-1}

元素分析 計算値 : C=56.61, H=8.71, N=3.67

分析値 : C=57.00, H=8.58, N=3.69

実施例 189 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2- {2- [4- (7-フルオロヘプチルオキシ) フェニル] エチル} プロパン

無色液体、R f 値 = 0.70 (酢酸エチル)

IR (neat) 3310, 1738, 1651, 1614, 1514, 1244, 815 cm^{-1}

実施例 190 : 2-アミノ-2- {2- [4- (1, 1-ジフルオロオクチル) フェニル] エチル} -1, 3-プロパンジオール

実施例 191 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2- {2- [4- (1, 1-ジフルオロオクチル) フェニル] エチル} プロパン

実施例 192 : 2-アミノ-2- {2- [4- (1, 1-ジフルオロヘプチルオキシ) フェニル] エチル} -1, 3-プロパンジオール

実施例 193 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2- {2- [4- (1, 1-ジフルオロヘプチルオキシ) フェニル] エチル} プロパン

実施例 194 : 2-アミノ-2- {2- [4- (4-メチルペンチル) フェニル] エチル} -1, 3-プロパンジオール

実施例 195 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2- {2- [4- (4-メチルペンチル) フェニル] エチル} プロパン

実施例 196 : 2-アミノ-2- {2- (4-フルオロフェニル) エチル} -1, 3-プロパンジオール塩酸塩、融点 = 169~170°C

実施例 197 : 2-アセトアミド-2- {2- (4-フルオロフェニル) エチル}

- 1, 3-プロパンジオール、融点=63~65°C

実施例 198: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-フルオロフェニル)エチル]プロパン

実施例 199: 2-アミノ-2-[2-(3-フルオロ-4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

実施例 200: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(3-フルオロ-4-オクチルフェニル)エチル]プロパン

実施例 201: 2-アミノ-2-[2-(2-エチル-4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

実施例 202: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(2-エチル-4-オクチルフェニル)エチル]プロパン

実施例 203: 2-アミノ-2-[2-(3-メチル-4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

実施例 204: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(3-メチル-4-オクチルフェニル)エチル]プロパン

実施例 205: 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルオキシ-3-メトキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール・1/2水和物・塩酸塩、融点=126~129°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.80 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.22-1.36 (8H, m), 1.70-1.76 (2H, m), 1.83-1.91 (2H, m), 2.50-2.54 (2H, m), 3.30 (3H, s), 3.77 (4H, s), 3.89 (2H, t, $J=8\text{Hz}$), 6.63-6.72 (3H, m)

IR ν 3179, 2931, 1617, 1518, 1240, 1036 cm^{-1}

実施例 206: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ヘプチルオキシ-3-メトキシフェニル)エチル]プロパン

融点=138~139°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.30-1.56 (10H, m), 1.96 (3H, s), 2.09 (6H, s),

2.18-2.22 (2H, m), 2.53-2.57 (2H, m), 3.86 (3H, s), 3.97 (2H, t, J=6Hz), 4.35 (4H, s), 5.65 (1H, s), 6.70-6.80 (3H, m)

IR ν 3291, 2930, 1738, 1258 cm^{-1}

元素分析 計算値: C=64.49, H=8.44, N=3.01

分析値: C=64.32, H=8.33, N=3.03

実施例 207: 2-アミノ-2-[2-(4-ヘブチルオキシ-3-メチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

実施例 208: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ヘブチルオキシ-3-メチルフェニル)エチル]プロパン

実施例 209: 2-アミノ-2-[2-(4-フェニルメチルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール・1/5水和物・塩酸塩

融点=207~210°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.90-1.95 (2H, m), 2.59-2.63 (2H, m), 3.71 (4H, q, J=12Hz), 5.04 (2H, s), 6.91 (2H, d, J=8Hz), 7.13 (2H, d, J=8Hz), 7.37-7.44 (5H, m)

IR ν 3422, 1617, 1508, 1245 cm^{-1}

実施例 210: 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-フェニルメチルオキシフェニル)エチル]プロパン

融点=150~153°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.95 (3H, s), 2.09 (6H, s), 2.15-2.20 (2H, m), 2.53-2.58 (2H, m), 4.34 (4H, s), 5.04 (2H, s), 5.64 (1H, s), 6.90 (2H, d, J=8Hz), 7.10 (2H, d, J=8Hz), 7.36-7.43 (5H, m)

IR ν 3318, 1763, 1736, 1654, 1250 cm^{-1}

元素分析 計算値: C=67.43, H=6.84, N=3.28

分析値: C=67.47, H=6.96, N=3.19

実施例 211: 2-アミノ-2-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

融点 = 180 ~ 185 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.61-1.66 (2H, m), 2.52-2.57 (2H, m), 3.57 (4H, s), 6.74 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.03 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)

I R ν 3355, 2923, 1602, 1474, 1232 cm^{-1}

元素分析 計算値 : C=62.54, H=8.11, N=6.63

分析値 : C=62.45, H=8.07, N=6.68

実施例 212 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル)プロパン

融点 = 100 ~ 105 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.98 (3H, s), 2.10 (6H, s), 2.17-2.22 (2H, m), 2.52-2.56 (2H, m), 4.34 (4H, s), 5.73 (1H, s), 6.76 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.03 (2H, d, $J=9\text{Hz}$)

I R ν 3590, 1741, 1577, 1243 cm^{-1}

実施例 213 : 2-アミノ-2-(9-フェニルオキシノニル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩

融点 = 103 ~ 104 °C

元素分析 計算値 : C=62.50, H=9.32, N=4.05

分析値 : C=62.21, H=9.39, N=3.95

実施例 214 : 2-アセトアミド-2-(9-フェニルオキシノニル)-1, 3-プロパンジオール

融点 = 71 ~ 73 °C

元素分析 計算値 : C=68.34, H=9.46, N=3.99

分析値 : C=68.34, H=9.44, N=4.01

実施例 215 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(9-フェニルオキシノニル)プロパン

実施例 216 : 2-アミノ-2-(12-フルオロドデシル)-1, 3-プロパンジオール・1/10水和物・塩酸塩、融点 = 87 ~ 89 °C

- 実施例 217 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(12-フルオロドデシル) プロパン、融点=57~59℃
- 実施例 218 : 2-アミノ-2-(13-フルオロトリデシル)-1, 3-プロパンジオール、
- 実施例 219 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(13-フルオロトリデシル) プロパン、
- 実施例 220 : 2-アミノ-2-{2-[4-(N-デシル-N-メチルアミノ)フェニル] エチル}-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 221 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-{2-[4-(N-デシル-N-メチルアミノ)フェニル] エチル} プロパン
- 実施例 222 : 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルチオフェニル) エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 223 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ヘプチルチオフェニル) エチル] プロパン
- 実施例 224 : 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルフェニル) エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 225 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ヘプチルフェニル) エチル] プロパン
- 実施例 226 : 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルフェニル)-2-オキソエチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 227 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ヘプチルフェニル)-2-オキソエチル] プロパン
- 実施例 228 : 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 229 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(4-ヘプチルフェニル)-2-ヒドロキシエチル] プロパン
- 実施例 230 : 2-アミノ-2-{2-[2-(4-ヘプチルフェニル)-1, 3-ジオキサラン-2-イル] エチル}-1, 3-プロパンジオール

ール

実施例 2 3 1 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2- {2- {2- (4-ヘプチルフェニル) -1, 3-ジオキソラン-2-イル} エチル} プロパン

実施例 2 3 2 : 2-アミノ-2- {2- (4-オクチルフェニル) -2-オキソエチル} -1, 3-プロパンジオール

実施例 2 3 3 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2- {2- (4-オクチルフェニル) -2-オキソエチル} プロパン

実施例 2 3 4 : 2-アミノ-2- {2- (4-オクチルフェニル) -2-ヒドロキシエチル} -1, 3-プロパンジオール

実施例 2 3 5 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2- {2- (4-オクチルフェニル) -2-ヒドロキシエチル} プロパン

実施例 2 3 6 : 2-アミノ-2- {2- {2- (4-オクチルフェニル) -1, 3-ジオキソラン-2-イル} エチル} -1, 3-プロパンジオール

実施例 2 3 7 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2- {2- {2- (4-オクチルフェニル) -1, 3-ジオキソラン-2-イル} エチル} プロパン

実施例 2 6 1 : 2-アミノ-2- (8-ヒドロキシテトラデシル) -1, 3-プロパンジオール塩酸塩

(1) 2-アセタミド-3-アセトキシ-2-アセトキシメチル-14-オキソイコサ-6-エン酸- δ -ラクトン

2-アミノ-3, 4-ジヒドロキシ-2-ヒドロキシメチル-14-オキソイコサ-6-エン酸 (20 g) に無水酢酸 (200 ml)、ピリジン (20 ml) を加え室温で一夜攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を 1 N 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、標記化合物 (22.9 g) を得た。

- (2) 14-ヒドロキシ-2-アセタミド-3-アセトキシ-2-アセトキシメチル-14-オキソイコサ-6-エン酸- δ -ラクトン

上記化合物 (12.8 g) のジオキサン溶液に脱イオン水 (150 ml) を加える。氷浴下、炭酸ガスを吹き込みながら約 30 分攪拌し、ガスを飽和させることによって溶液を弱酸性にした。水素化ホウ素ナトリウム (2.41 g) を加え、1 時間攪拌した。反応溶液を 1 N 塩酸で酸性にした後、1 N 水酸化ナトリウムで弱酸性にした。これを濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; クロロホルム: メタノール = 50 : 1) にて精製すると、標記化合物 (7.49 g) を得た。

IR : 3440, 2920, 2850, 1750, 1680 cm^{-1}

- (3) 14-t-ブチルジメチルシリルオキシ-2-アセタミド-3-アセトキシ-2-アセトキシメチル-14-オキソイコサ-6-エン酸- δ -ラクトン

上記化合物 (7.49 g) の N, N-ジメチルホルムアミド (75 ml) 溶液にイミダゾール (4.97 g)、t-ブチルジメチルシリルクロライド (5.50 g) を加え、60°C で 1 時間攪拌した。反応溶液を氷浴下、脱イオン水を加え、30 分攪拌後、室温で 30 分攪拌した。脱イオン水を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を濃縮し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1 : 2) にて精製すると、標記化合物 (8.50 g) を得た。

IR : 3440, 2920, 2850, 1750, 1680, 830 cm^{-1}

- (4) 5, 6-ジヒドロキシ-14-t-ブチルジメチルシリルオキシ-2-アセタミド-3-アセトキシ-2-アセトキシメチル-14-オキソイコサ-6-エン酸- δ -ラクトン

上記化合物 (8.50 g) のアセトン (207 ml) 溶液に、N-メチルモルホリン-N-オキシド (3.19 g)、1% オスミウム水溶液 (34.5 ml) を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢

酸エチル層を飽和亜硫酸ナトリウム溶液、1 N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、標記化合物 (8.05 g) を得た。

IR : 3440, 2920, 2850, 1750, 1680, 830 cm^{-1}

(5) 8-*t*-ブチルジメチルシリルオキシテトラデカナール

上記化合物 (8.05 g) のジオキサン (610 ml) 溶液に0.2 N過ヨウ素酸ナトリウム水溶液 (183 ml) を加え、室温で2時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、ヘキサンにて抽出し、ヘキサン層を硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、標記化合物 (4.1 g、収率98.4%) を得た。

IR : 2920, 2850, 1720, 830 cm^{-1}

(6) 8-*t*-ブチルジメチルシリルオキシテトラデカノール

上記化合物 (4.1 g) のジオキサン (120 ml) 溶液に脱イオン水 (40 ml) を加え、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム (1.15 g) を加える。室温で30分攪拌した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を1 N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル:ヘキサン=1:10) にて精製すると、標記化合物 (3.74 g) を得た。

IR : 2920, 2850, 1710, 830 cm^{-1}

(7) 1-ヨード-8-*t*-ブチルジメチルシリルオキシテトラデカン

上記化合物 (3.74 g) のベンゼン (200 ml) 溶液にイミダゾール (1.85 g)、トリフェニルホスフィン (7.14 g)、ヨウ素 (5.53 g) を加え、室温で30分攪拌した。酢酸エチルにて抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、酢酸エチル層を硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; ヘキサン) にて精製すると、標記化合物 (4.42 g) を得た。

IR : 2920, 2850, 830 cm^{-1}

(8) 2-アセトアミド-2-(8-*t*-ブチルジメチルシリルオキシテトラデシ

ル) マロン酸ジエチル

上記化合物 (4. 42 g) の脱水エタノール (200 ml) 溶液にアセトアミドマロン酸ジエチル (2. 54 g)、ナトリウムエトキシド (0. 80 g) を加え、窒素気流下、一夜、加熱還流した。反応溶液を濃縮後、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=1: 10) にて精製すると標記化合物 (2. 81 g) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.03 (6H, s), 0.84 (9H, m), 1.23 (18H, m), 1.23 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$),
1.35 (3H, m), 2.01 (3H, s), 2.28 (2H, m), 3.57 (1H, q, $J=6.0\text{Hz}$),
4.215 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 6.74 (1H, s)

IR: 3440, 2920, 2850, 1740, 1680, 830 cm^{-1}

(9) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(8-*t*-ブチルジメチルシリルオキシテトラデシル) プロパン

上記化合物 (3. 38 g) のメタノール (13 ml) 溶液に水素化ホウ素ナトリウム (1. 77 g) を加え、室温で1時間放置後、反応溶液を酢酸エチルにて抽出し、1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄した。酢酸エチル層を硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣に無水酢酸 (19. 6 ml)、ピリジン (1. 96 ml) を加え、室温で一夜攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=1: 2) にて精製すると、標記化合物 (2. 04 g) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.009 (6H, s), 0.86 (3H, t), 0.86 (9H, s), 1.24 (18H, m), 1.36 (4H, m), 1.82 (2H, m), 1.94 (3H, s), 2.06 (6H, s), 3.58 (1H, q, $J=8\text{Hz}$),
4.26 (2H, d, $J=11.2\text{Hz}$), 4.29 (2H, d, $J=11.3\text{Hz}$), 5.59 (1H, s)

IR: 3440, 2920, 2850, 1740, 1680, 830 cm^{-1}

(10) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(8-ヒドロキシテトラデシル)プロパン

上記化合物(2.04 g)の0.01 N塩酸-メタノール(37.6 ml)溶液を室温で3時間放置した。脱イオン水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和塩化ナトリウム溶液にて順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=1:1)にて精製すると、標記化合物(1.15 g)を得た。

融点=82~84°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.26 (18H, m), 1.40 (4H, m), 1.82 (2H, m),
1.93 (3H, s), 2.05 (6H, s), 3.55 (1H, m), 4.25 (2H, d, $J=11.2\text{Hz}$),
4.28 (2H, d, $J=11.7\text{Hz}$), 5.59 (1H, s)

IR : 3440, 2920, 2850, 1720, 1680 cm^{-1}

(11) 2-アミノ-2-(8-ヒドロキシテトラデシル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

上記化合物(300 mg)のメタノール(12.6 ml)溶液に1 N水酸化ナトリウムを加え、窒素気流下、6時間加熱還流した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣に1 N塩酸-メタノール(1.4 ml)を加え、濃縮すると標記化合物(230 mg)を得た。

融点=106~108°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.84 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.22 (22H, m), 1.48 (2H, d, $J=10.3\text{Hz}$), 3.40
(2H, d, $J=10.3\text{Hz}$), 3.44 (2H, d, $J=12.2\text{Hz}$), 4.21 (1H, m), 5.28 (2H,
br.s), 7.74 (3H, br.s)

IR : 3350, 2900, 2850 cm^{-1}

実施例 262 : 2-アミノ-2-(8-オキシテトラデシル)-1, 3-プロパ

ンジオール塩酸塩

- (1) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(8-オキソテトラデシル)プロパン

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(8-ヒドロキシテトラデシル)プロパン (300 mg) のジクロロメタン (19 ml) 溶液に、クロクロム酸ピリジニウム (301.5 mg) を加え、窒素気流下、室温で2時間攪拌した。エーテル (38 ml)、硫酸マグネシウム (適量) を加え、10分攪拌後、吸引濾過し、濾液を濃縮した。酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を1N塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、標記化合物 (290 mg) を得た。

融点 = 88 ~ 89 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 1.27 (14H, m), 1.55 (4H, m), 1.84 (2H, dd, $J=8.8, 15.6\text{Hz}$), 2.08 (6H, s), 2.38 (4H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 4.28 (2H, d, $J=11.3\text{Hz}$), 4.31 (2H, d, $J=11.2\text{Hz}$), 5.63 (1H, s)

IR : 2920, 2850, 1740 ~ 1680 cm^{-1}

- (2) 2-アミノ-2-(8-オキソテトラデシル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

上記化合物 (290 mg) のメタノール (12.2 ml) 溶液に1N水酸化ナトリウム (4.1 ml) を加え、窒素気流下、6時間、加熱還流した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶液を留去し、得られた残渣に1N塩酸-メタノール (1.2 ml) を加え濃縮した。得られた残渣を酢酸エチルにて再結晶すると、標記化合物 (176 mg) を得た。

融点 = 121 ~ 122 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.614 (3H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 1.03 (18H, m), 1.28 (4H, m), 1.41 (2H, m), 2.12 (4H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 3.38 (2H, d, $J=12.2\text{Hz}$), 3.48 (2H, d, $J=12.2\text{Hz}$),

4.71 (2H, br.s), 7.65 (3H, br.s)

IR : 3420~3340, 3030, 2920, 2850, 1700 cm^{-1}

実施例 263 : 2-アミノ-2-(2-N-ドデシルアミノエチル)-1, 3-
プロパンジオール塩酸塩

(1) アミノマロン酸ジエチル塩酸塩 10 g を N, N-ジメチルホルムアミド 100 ml に溶解し、トリエチルアミン 6.3 g およびジ-*t*-ブチルジカーボネート 12.1 g を加え、60℃にて1時間、攪拌した。氷冷下、反応液に水を加え、室温で攪拌後、エーテル抽出し、脱水後、濃縮した。さらにヘキサノン酢酸エチル (10 : 1 → 5 : 1) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色油状物の N-*t*-ブトキシカルボニルアミノマロン酸ジエチル 13 g を得た。

IR ν_{max} (CHCl_3) : 3450, 2970, 1740(sh), 1710, 1490, 1375, 1340, 1160, 1060, 1020, 860 cm^{-1}

(2) N-*t*-ブトキシカルボニルアミノマロン酸ジエチル 5 g を脱水エタノール 100 ml に溶解し、ナトリウムエトキシド 1.53 g および臭化アリル 2.7 g を加え、窒素雰囲気下、12時間還流した。反応液を濃縮し、ヘキサノン酢酸エチル (20 : 1 → 10 : 1 → 8 : 1) を展開後としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色油状物の 2-アリル-N-*t*-ブトキシカルボニルアミノマロン酸ジエチル 4.8 g を得た。

IR ν_{max} (CHCl_3) : 3450, 2980, 2860, 1740(sh), 1710, 1480, 1400, 1370, 1310, 1160, 1080, 1060, 1020, 915, 860 cm^{-1}

(3) 2-アリル-N-*t*-ブトキシカルボニルアミノマロン酸ジエチル 4.8 g をメタノール 30 ml に溶解し、水素化ホウ素ナトリウム 4.34 g を加え、室温で2時間放置した。反応液に酢酸エチルを加え、1N-塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄後、脱水、濃縮した。残渣を N, N-ジメチルホルムアミド 32 ml に溶解し、イミダゾール 5.72 g および塩化 *t*-ブチルジメチルシリル 6.33 g を加え、60℃で1時間、攪

拌した。氷冷下、反応液に水を加え、室温で攪拌後、エーテル抽出し、脱水後、濃縮した。さらにヘキサン-酢酸エチル(10:1)を展開液としたシリカゲルカラムクロマトにより精製し、無色油状物の2-アリル-2-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-1,3-プロパンジオールビス-tert-ブチルジメチルシリルエーテル3.8gを得た。

Rf値=0.7(ヘキサン-酢酸エチル=10:1)

(4) 2-アリル-2-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-1,3-プロパンジオールビス-tert-ブチルジメチルシリルエーテル3.8gをアセトン300mlに溶解し、N-メチルモルホリン-N-オキシド2.45gおよび1%四酸化オスミウム水溶液43mlを加え、室温で4時間、攪拌した。反応液を濃縮し、酢酸エチルを加え、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、1N塩酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄した。脱水後、濃縮し、無色油状物の2-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-2-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-1,3-プロパンジオールビス-tert-ブチルジメチルシリルエーテル4.3gを得た。

IR ν_{max} (CHCl₃): 3450(br), 2940, 2850, 1710, 1500, 1470, 1400, 1370, 1260, 1160, 1080(br), 840 cm⁻¹

(5) 2-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-2-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-1,3-プロパンジオールビス-tert-ブチルジメチルシリルエーテル4.3gを1,4-ジオキサン600mlに溶解し、メタ過ヨウ素酸ナトリウム3.8gの水90ml溶液を加え、室温で3時間、攪拌した。反応液を濃縮し、ヘキサンを加え、水洗した。脱水後、濃縮し、無色油状物の2-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-2-(2-ホルミルエチル)-1,3-プロパンジオールビス-tert-ブチルジメチルシリルエーテル3.76gを得た。

Rf値=0.7(ヘキサン-酢酸エチル=5:1)

(6) 2-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-2-(2-ホルミルエチル)-1,3-プロパンジオールビス-tert-ブチルジメチルシリルエーテル1.2gをメタノール20mlに溶解し、氷冷下、ドデシルアミン2.89gの濃塩酸

ーメタノール (1 : 1 : 1) 5. 2 ml 溶液、および水素化シアノホウ素ナトリウム 245 mg を加え、室温で一夜、攪拌した。反応液を濃縮し、酢酸エチルを加え、1 N 塩酸水溶液を水層が酸性を呈するまで加え、さらに 1 N 水酸化ナトリウム水溶液を水層が弱アルカリ性を呈するまで加えた後、分液した。酢酸エチル層を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、脱水後、濃縮した。さらに、ヘキサンー酢酸エチル (3 : 1 → 2 : 1 → 1 : 1) を展開液としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、無色油状物の 2 - (2 - N - ドデシルアミノエチル) - 2 - (N - t - ブトキシカルボニルアミノ) - 1, 3 - プロパンジオール ビス - t - ブチルジメチルシリルエーテル 956 mg を得た。

IR ν_{\max} (CHCl₃): 3450, 2920, 2850, 1710, 1500, 1460, 1400, 1370, 1260, 1160, 1100(br), 840 cm⁻¹

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

5.31 (1H, s, NH₂Boc), 3.69 (2H, d, 8Hz, OCH₂ × 2), 3.61 (2H, d, 8Hz, OCH₂ × 2), 2.66 (2H, t, 8Hz, H₂C-N), 2.55 (2H, t, 8Hz, N-CH₂), 1.85 (2H, t, 8Hz, -C-CH₂), 1.40 (9H, s, Boc.-t-Bu), 1.24 (20H, m, CH₂ × 10), 0.85 (21H, m, Si-tBu × 2 および CH₂CH₃), 0.03 (12H, s, Si-CH₃ × 4)

(7) 2 - (2 - N - ドデシルアミノエチル) - 2 - (N - t - ブトキシカルボニルアミノ) - 1, 3 - プロパンジオール ビス - t - ブチルジメチルシリルエーテル 100 mg をメタノール 2 ml に溶解し、濃塩酸 - メタノール (1 : 1 : 1) 1.6 ml を加え、40 °C で 3 時間加温した。反応液を濃縮し、淡黄色油状物の 2 - アミノ - 2 - (2 - N - ドデシルアミノエチル) - 1, 3 - プロパンジオール 塩酸塩 58 mg を得た。

IR ν_{\max} (KBr) : 3350(br), 2920, 2850, 1600, 1460, 1060

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ :

9.00 (2H, br.s, ⁺NH₂Cl⁻), 8.04 (3H, br.s, ⁺NH₃Cl⁻), 5.51 (2H, s, OH × 2), 3.47 (2H, s, OCH₂), 3.45 (2H, s, OCH₂), 2.99 (2H, m, H₂CN), 2.81 (2H, m, NCH₂), 1.96 (2H, m, -C-CH₂), 1.23 (20H, m, CH₂ × 10), 0.84 (3H, t, 6.8Hz, CH₃)

実施例 264 : 2-アミノ-2-(11-メトキシカルボニルウンデシル)-1,
3-プロパンジオール塩酸塩

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(12-ヒドロキシドデシル)プロパン 426 mg を乾燥ジメチルホルムアミド 2.7 ml に溶解し、ピリジニウムジクロメイト 1.345 g を加えて窒素雰囲気下室温で一昼夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、エーテルで2回抽出し、エーテル層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。残渣にメタノール 17 ml と 1N-水酸化ナトリウム水溶液 4.23 ml を加えて、窒素雰囲気下、6時間加熱還流した。反応液を強酸性イオン交換樹脂アンバーライト IR-120 B カラムに通液し、溶出液を濃縮した。濃縮残渣をメタノールに溶解し、塩酸酸性とした後、減圧下に溶媒を留去し、標記化合物 122 mg を得た。

融点 = 100.0 ~ 104.0 °C

IR (cm⁻¹) : 3370, 2920, 2850, 1740, 1500, 1470, 1170, 1080

NMR (DMSO) δ :

7.684 (3H, br.s), 5.275 (2H, br.s), 3.563 (3H, s), 3.441 (1H, d, J=11.2Hz), 3.430 (1H, d, J=11.2Hz), 3.402 (1H, d, J=11.7Hz), 3.390 (1H, d, J=11.2Hz), 2.272 (2H, t, J=7.3Hz), 1.229 (20H, s)

実施例 265 : 2-アミノ-2-(11-カルボキシウンデシル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

2-アミノ-2-(11-メトキシカルボニルウンデシル)-1, 3-プロパンジオール塩酸塩 10 mg に 2N-塩酸 0.5 ml を加えて 90 °C で 1 時間加熱した。減圧下に溶媒を留去して、標記化合物 10 mg を得た。

NMR (DMSO) δ :

11.992 (1H, br.s, COOH), 7.771 (3H, br.s, *NH₂), 5.292 (2H, t, J=4.9Hz, OH×2), 3.417 (4H, ddd, J=16.5, 11.7, 5.0Hz, CH₂O×2), 2.168 (2H, t, J=7.4Hz, CH₂COO), 1.224 (20H, s, CH₂×10)

実施例 266 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(8-アセトキシテトラデシル)プロパン

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.24 (18H, m), 1.47 (4H, m), 1.82 (2H, m),
1.94 (3H, s), 2.05~2.01 (9H, s), 4.25 (2H, d, $J=11.7\text{Hz}$), 4.29 (2H,
d, $J=11.7\text{Hz}$), 4.83 (1H, q, $J=6.3\text{Hz}$), 5.62 (1H, s)

IR : 3400, 2920, 2850, 1720, 1680 cm^{-1}

実施例 267 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(3, 7, 11-トリメチルドデシル) プロパン

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

5.589 (1H, br.s), 4.293 (4H, dd, $J=13.7, 12.3\text{Hz}$), 2.073 (6H, s),
1.956 (3H, s), 1.857 (1H, qui, $J=13.7\text{Hz}$), 1.844 (1H, qui, $J=13.3\text{Hz}$),
1.513 (1H, 7重線, $J=6.6\text{Hz}$), 1.345~1.040 (16H, m), 0.857 (6H, d,
 $J=6.4\text{Hz}$), 0.848 (3H, d, $J=6.4\text{Hz}$), 0.831 (3H, d, $J=6.8\text{Hz}$)

実施例 268 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-(3, 7, 11-トリメチル-2, 6, 10-トリデセニル) プロパン

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

5.57 (1H, br.s), 5.07 (3H, m), 4.28 (4H, s), 2.60 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$),
2.01 (6H, s), 2.05~1.94 (8H, m), 1.94 (3H, s), 1.70~1.57 (12H, m)

実施例 269 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(11-メトキシカルボニルウンデシル) プロパン

融点 = 49.5~51.5 $^{\circ}\text{C}$

IR ν : 3300, 2930, 2850, 1740, 1655, 1580, 1475, 1390, 1240, 1060
 cm^{-1}

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

5.61 (1H, br.s), 4.265 (4H, dd, $J=13.6\text{Hz}, 11.2\text{Hz}$), 3.635 (3H, s),
2.272 (2H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 2.051 (6H, s), 1.934 (3H, s), 1.836~1.817
(2H, m), 1.225 (18H, br.s)

実施例 270 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-(12-アセトキシドデシル) プロパン

融点 = 67.5 ~ 69.0 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

5.607 (1H, br.s), 4.267 (4H, dd, $J=13.7, 11.3\text{Hz}$), 4.021 (2H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 2.052 (6H, s), 2.017 (3H, s), 1.934 (3H, s), 1.840 ~ 1.819 (2H, m), 1.225 (20H, br.s)

実施例 271 : 2-アミノ-2-(1, 2, 12-トリヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, in CD_3OD) δ :

3.85~3.73 (7H, m), 1.60 (2H, m), 1.45~1.25 (26H, m), 0.90 (3H, t)

$\text{IR } \nu_{\text{max}}$ (KBr) : 3350(br), 2920, 2850, 1560, 1480, 1420, 1060 cm^{-1}

実施例 272 : 2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシ-12-オキソオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, in CD_3OD) δ :

5.48 (2H, m), 3.86~3.72 (6H, m), 2.44 (4H, t), 2.29 (2H, t), 2.02 (2H, t), 1.53 (4H, quintet), 1.29 (12H, br.s), 0.89 (3H, t)

$\text{IR } \nu_{\text{max}}$ (CHCl_3) : 3300, 2925, 2850, 1710, 1560, 1420, 1060, 980 cm^{-1}

実施例 273 : 2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシ-12-ヒドロキシミノオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, in CD_3OD) δ :

3.85~3.73 (4H, m), 2.42 (2H, t), 2.15 (2H, t), 1.62~1.32 (24H, m), 0.89 (3H, t)

$\text{IR } \nu_{\text{max}}$ (CHCl_3) : 3300(br), 2920, 2850, 1560, 1420, 1050 cm^{-1}

実施例 274 : 2-アミノ-2-(1, 2, 12-トリヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール

2-アミノ-3-ヒドロキシ-2-(1, 2-ジヒドロ-12-オキソ-4-オクタデセニル)プロピオン酸のラクトン体 2.00 g を乾燥テトラヒドロフラン 66 ml に溶解し、室温で攪拌しながら水素化アルミニウムリチウム 800 m

gを少量ずつ加えた。混合物を室温で40分間攪拌後、水0.8ml、15%水酸化ナトリウム水溶液0.8ml、水2.4mlを順次加え、不溶物を濾去した。得られた濾液を減圧濃縮し、残渣を水洗後、減圧下で乾燥し、標記化合物408mgを得た。

IR ν_{\max} (KBr) : 3280, 2920, 2850, 1640, 1470, 1400, 1075, 970 cm^{-1}

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, in CD_3OD , Ref: TMS), δ :
5.57 (1H, dt, $J=15.3$ and 6.6Hz), 5.43 (1H, dt, $J=15.3$ and 6.9Hz),
3.85 (1H, dt, $J=6.9$ and 1.0Hz), 3.84~3.73 (5H, m), 3.67 (1H, d, $J=1.0\text{Hz}$),
2.31 (2H, br. t, $J=6.7\text{Hz}$), 2.02 (2H, br. q, $J=6.4\text{Hz}$), 1.42~1.31 (20H, m), 0.90 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$)

実施例275: 2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール

2-アミノ-3-ヒドロキシ-2-(1, 2-ジヒドロキシ-4-オクタデセニル)プロピオン酸のラクトン体978mgと水素化アルミニウムリチウム403mgとを乾燥テトラヒドロフラン33ml中で実施例274の方法に準じて、反応させることにより、標記化合物222mgを得た。

IR ν_{\max} (KBr) cm^{-1} : 3300, 2920, 2850, 1575, 1480, 1390, 1060, 1105, 975

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, in CD_3OD , Ref: TMS), δ :
5.57 (1H, dt, $J=15.4$ and 6.4Hz), 5.42 (1H, dt, $J=15.4$ and 6.5Hz),
3.88~3.66 (6H, m), 2.31 (2H, t, $J=6.7\text{Hz}$), 2.04~1.93 (2H, m), 1.28 (22H, br. s), 0.90 (t, $J=6.5\text{Hz}$)

実施例276: 2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール

2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール68.0mgをメタノール14mlに溶解し、5%パラジウム-炭素を6.8mg加え、常温、常圧で一昼夜接触還元を行った。反応後、触媒

を濾別し、濾液を減圧濃縮し、標記化合物 34. 3 mg を得た。

IR ν_{max} (KBr) cm^{-1} : 3300, 2920, 2850, 1575, 1460, 1370, 1060

1H -NMR (200 MHz, in CD_3OD , Ref: TMS), δ :

3.77 (6H, m), 1.65 (2H, m), 1.27 (28H, br.s), 0.89 (3H, t, $J=6.5Hz$)

実施例 277: 2-アミノ-2-(1, 12-ジヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール

実施例 274 の方法に準じて、2-アミノ-3-ヒドロキシ-2-(1-ヒドロキシ-12-オキソ-4-オクタデセニル) プロピオン酸 35. 0 mg と水素化アルミニウムリチウム 14. 4 mg とを乾燥テトラヒドロフラン 2. 0 ml 中で反応させることにより、標記目的物 8. 9 mg を得た。

IR ν_{max} (KBr) cm^{-1} : 3300, 2920, 2850, 1640, 1400, 970

1H -NMR (200 MHz, in CD_3OD , Ref: TMS), δ :

5.40 (2H, m), 3.97~3.70 (5H, m), 3.58 (1H, m), 1.94 (4H, m), 1.70~

1.21 (22H, m), 0.88 (3H, t, $J=6.5Hz$)

上記と同様にして次の化合物が得られる。

実施例 278: 2-アミノ-2-(1, 2, 12-トリヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール

実施例 279: 2-アミノ-2-(1, 12-ジヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール

実施例 280: 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

(1) 2-(4-ヘプチルオキシフェニル)エタノール

メタノール (120 ml) に 2-(4-ヒドロキシフェニル)エタノール (10. 0 g) とナトリウムメトキシド (4. 30 g) を加え、30 分間加熱還流した。これにヘプチルブロマイド (14. 2 g) のメタノール (30 ml) 溶液を滴下し、加熱還流下 6 時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒: 酢酸

エチル：ヘキサン=1：2)にて精製すると、標記化合物(10.81g)を得た。

融点=37~39°C

Rf値：0.44(酢酸エチル：n-ヘキサン=1：2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.89(3H, t, $J=6.0\text{Hz}$), 1.10-1.99(11H, m), 2.81(2H, t, $J=6.25\text{Hz}$), 3.68-4.05(4H, m), 6.85(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.15(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$)

IR : 3312, 1610, 1514, 1249 cm^{-1}

MS (EI) : 236(M^+)

(2) 2-(4-ヘプチルオキシフェニル)エチルメタンスルホネート

上記化合物(10.81g)のテトラヒドロフラン(300ml)溶液にトリエチルアミン(4.2g)を加え、氷冷した。これにメタンスホニルクロライド(5.23g)を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒：酢酸エチル：ヘキサン=1：5)にて精製すると、標記化合物(11.32g)を得た。

融点=35~36°C

Rf値：0.33(酢酸エチル：n-ヘキサン=1：2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.90(3H, t, $J=6.0\text{Hz}$), 1.10-1.95(10H, m), 2.86(3H, s), 3.00(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 3.94(2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 4.39(2H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 6.85(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.15(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$)

IR : 1354, 1516, 1249 cm^{-1}

MS (EI) : 314(M^+)

(3) 2-(4-ヘプチルオキシフェニル)エチル ヨーダイド

上記化合物(11.32g)の2-ブタノン(400ml)溶液にヨウ化ナトリウム(10g)を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルに

て抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝１：５）にて精製すると、標記化合物（９．０７ｇ）を抽出物として得た。

R f 値：０．８０（酢酸エチル：n-ヘキサン＝１：２）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.89(3H, t, $J=6.0\text{Hz}$), 1.10-1.96(10H, m), 2.98-3.48(4H, m), 3.94(2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 6.84(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.11(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$)

IR : 1610, 1512, 1246 cm^{-1}

MS (EI) : 346(M^+)

(4) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-ヘプチルオキシフェニル) エチル マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル（１５ｇ）に窒素気流下、ナトリウムエトキシド（４．９９ｇ）の無水エタノール（６０ml）溶液を滴下し、６５℃で３０分攪拌した。次に、上記化合物（８．０ｇ）のテトラヒドロフラン（３０ml）溶液を滴下し、６５℃で６時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝１：５）にて精製すると、標記化合物（６．５０ｇ）を得た。

融点＝７７～８０℃

R f 値：０．４４（クロロホルム：メタノール＝９：１）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.89(3H, t, $J=6.0\text{Hz}$), 1.05-1.90(16H, m), 1.98(3H, s), 2.10-2.85(4H, m), 3.92(2H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 4.21(4H, q, $J=7.5\text{Hz}$), 6.65(1H, br.s), 6.79(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.05(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$)

IR : 3242, 1745, 1641, 1614, 1512, 1296 cm^{-1}

MS (EI) : 435(M^+)

(5) 1, 3-プロパンジイル-2-アセトアミド-2-[2-(4-ヘプチルオキシフェニル)エチル]イリデンジアセテート

水素化アルミニウムリチウム (1.70 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (150 ml) に、窒素気流下、上記化合物 (6.50 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (50 ml) を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン (66 ml) を加えた。氷冷下、無水酢酸 (14 ml) を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒: 酢酸エチル) にて精製すると、標記化合物 (4.54 g) を白色結晶として得た。

融点 = 89 ~ 91 °C

Rf 値: 0.35 (クロロホルム: メタノール = 9:1)

¹H-NMR (CDCl₃) δ:

0.89(3H, t, J=6.0Hz), 1.05-2.72(14H, m), 1.95(3H, s), 2.08(6H, s),
3.92(2H, t, J=7.0Hz), 4.34(4H, s), 5.65(1H, br.s), 6.80(2H, d,
J=8.7Hz), 7.10(2H, d, J=8.7Hz)

IR: 3308, 1739, 1651, 1614, 1514, 1246 cm⁻¹

MS (EI): 435(M⁺)

(6) 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルオキシフェニル)エチル]1, 3-プロパンジオール塩酸塩

上記化合物 (4.54 g) のメタノール (70 ml) - テトラヒドロフラン (70 ml) 溶液に水酸化リチウム (3.93 g) の水溶液 (100 ml) を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて再結晶した。得られた結晶のテトラヒドロフラン (28 ml) - メタノール (28 ml) 溶液に1M塩酸/エーテル溶液 (43 ml) を加えた。溶媒を留去し、析出した結晶を酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合

物 (1.30 g) を得た。

融点 = 111 ~ 112 °C

Rf 値 : 0.20 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1)

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

0.88(3H, t, J=5.5Hz), 1.10-1.91(14H, m), 3.56(4H, t, J=5.0Hz), 5.36
(2H, t, J=4.5Hz), 6.84(2H, d, J=8.7Hz), 7.13(2H, d, J=8.7Hz), 7.85
(2H, br.s)

IR : 3279, 1610, 1514, 1246 cm⁻¹

MS (EI) : 309(M⁺)

元素分析 計算値 C; 62.50, H; 9.32, N; 4.05

分析値 C; 62.06, H; 9.11, N; 4.13

実施例 281 : 2-アミノ-2-[2-(4-ノニルオキシフェニル)エチル]
-1,3-プロパンジオール

(1) 2-(4-ノニルオキシフェニル)エタノール

メタノール (120 ml) に 2-(4-ヒドロキシフェニル)エタノール (10.0 g) とナトリウムメトキシド (4.30 g) を加え、30 分間加熱還流した。これにノニルブロマイド (33 g) のメタノール (20 ml) 溶液を滴下し、加熱還流下 6 時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 : 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 3) にて精製すると、標記化合物 (20 g) を得た。

Rf 値 : 0.46 (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 2)

(2) 2-(4-ノニルオキシフェニル)エチルメタンスルフォネート

上記化合物 (20 g) のテトラヒドロフラン (500 ml) 溶液にトリエチルアミン (8.8 g) を加え、氷冷した。これにメタンスルホンクロライド (9.17 g) を滴下し、室温にて 4 時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1% 塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒：酢酸エチル：ヘキサン＝1：3）にて精製すると、標記化合物（19.6 g）を得た。

融点＝37～42℃

Rf値：0.45（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：2）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.89(3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.05-1.90(16H, m), 2.82(3H, s), 2.99(2H, t, $J=6.1\text{Hz}$), 3.90(2H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 4.35(2H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 6.78(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.06(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 1354, 1251 cm^{-1}

MS (EI) : 342(M^+)

(3) 2-(4-ノニルオキシフェニル)エチル ヨーダイド

上記化合物（19.6 g）の2-ブタノン（650 ml）溶液にヨウ化ナトリウム（17 g）を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒：酢酸エチル：ヘキサン＝1：3）にて精製すると、標記化合物（18.08 g）を油状物として得た。

Rf値：0.69（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：2）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.90(3H, t, $J=5.5\text{Hz}$), 1.05-1.90(14H, m), 2.90-3.40(4H, m), 3.90(2H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 6.76(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.02(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 1610, 1512, 1246 cm^{-1}

MS (EI) : 374(M^+)

(4) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-ノニルオキシフェニル)エチルマロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル（31 g）に窒素気流下、ナトリウムエトキシド（10.4 g）の無水エタノール（135 ml）溶液を滴下し、65℃で30分間攪拌した。次に、上記化合物（18 g）のテトラヒドロフラン（63 ml）

溶液を滴下し、65℃で6時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝1：3）にて精製すると、標記化合物（8.78g）を得た。

融点＝76～77℃

Rf値：0.38（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：2）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.89(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.05-1.80(20H, m), 1.99(3H, s), 2.20-2.75(4H, m), 3.88(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$), 4.15(4H, q, $J=6.9\text{Hz}$), 6.70(1H, br.s), 6.72(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 6.99(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 3281, 1743, 1645, 1512, 1246 cm^{-1}

MS (EI) : 463(M^+)

(5) 1, 3-プロパンジイル-2-アセトアミド-2-[2-(4-ノニルオキシフェニル)エチル]イリデンジアセテート

水素化アルミニウムリチウム（1.79g）の無水テトラヒドロフラン溶液（150ml）に、窒素気流下、上記化合物（8.78g）の無水テトラヒドロフラン溶液（50ml）を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン（84ml）を加える。氷冷下、無水酢酸（18ml）を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出する。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル）にて精製すると、標記化合物（5.62g）を白色結晶として得た。

融点＝88～94℃

Rf値：0.50（クロロホルム：メタノール＝9：1）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.89(3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.05-2.30(18H, m), 1.93(3H, s), 2.06(6H, s),

3.89(2H, t, J=7.0Hz), 4.30(4H, s), 5.60(1H, br.s), 6.72(2H, d, J=8.2Hz), 7.01(2H, d, J=8.2Hz)

I R : 3308, 1738, 1651, 1614, 1514, 1246 cm^{-1}

MS (E I) : 463(M^+)

元素分析 計算値 C; 67.36, H; 8.91, N; 3.02

分析値 C; 67.35, H; 8.77, N; 3.05

(6) 2-アミノ-2-[2-(4-ノニルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

上記化合物 (5.62 g) のメタノール (86 ml) - テトラヒドロフラン (86 ml) 溶液に水酸化リチウム (4.57 g) の水溶液 (54 ml) を加え、3時間加熱還流した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて結晶した。得られた結晶のテトラヒドロフラン (40 ml) - メタノール (40 ml) 溶液に1M塩酸/エーテル溶液 (20 ml) を加えた。溶媒を留去し、析出した結晶を酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合物 (2.10 g) を得た。

融点 = 106 ~ 108 °C

Rf 値 : 0.14 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1)

^1H -NMR (CDCl_3) δ :

0.85(3H, t, J=4.1Hz), 1.10-1.90(18H, m), 3.50(4H, d, J=4.7Hz), 3.88(2H, t, J=5.4Hz), 5.32(2H, t, J=4.9Hz), 6.75(2H, d, J=8.2Hz), 7.02(2H, d, J=8.2Hz), 7.81(2H, br.s)

I R : 3277, 1610, 1514, 1248 cm^{-1}

MS (E I) : 337(M^+)

元素分析値 計算値 C; 64.24, H; 9.70, N; 3.75

分析値 C; 64.16, H; 9.51, N; 3.70

実施例 282 : 2-アミノ-2-[2-(4-(N-ヘプチル-N-メチルアミノ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

(1) 2-(4-ヘプタノイルアミノフェニル)エタノール

テトラヒドロフラン (300 ml) に 2-(p-アミノフェニル)エチルアルコール (13.8 g) とトリエチルアミン (10.8 g) を加え、氷冷下 30 分間攪拌した。これに塩化ヘプタノイル (15 g) を滴下し、氷冷下 30 分間攪拌した。さらに、室温で 3 時間攪拌した後、反応溶液を、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣について酢酸エチル-イソプロピルアルコールで再結晶することにより、標記化合物 (13.15 g) を得た。

融点 = 105 ~ 110 °C

Rf 値 : 0.41 (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 2 → 1 : 1)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ :

0.89(3H, t, J=6.8Hz), 1.31-1.42(8H, m), 1.70(2H, tt, J=7.3Hz, J=7.8Hz), 2.35(2H, t, J=7.3Hz), 2.83(2H, t, J=6.4Hz), 3.84(2H, dd, J=6.3Hz, J=5.8Hz), 7.12(1H, br.s), 7.18(2H, d, J=8.3Hz), 7.45(2H, d, J=8.3Hz)

IR : 3302, 1660, 1593, 1412 cm⁻¹

MS (EI) : 249(M⁺1)

元素分析値 計算値 C; 70.97, H; 9.33, N; 5.52

分析値 C; 71.30, H; 9.26, N; 5.66

(2) 2-(4-ヘプタノイルアミノフェニル)エトキシテトラヒドロピラン

テトラヒドロフラン (50 ml) とジクロロメタン (50 ml) に上記化合物 (7.0 g)、3,4-ジヒドロ-2H-ピラン (3.08 g) と p-トルエンスルホン酸 (180 mg) を加え、7 時間室温で攪拌した。これにトリエチルアミン (0.5 ml) を加え、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 : 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 1) にて精製すると、標記化合物 (11 g) を得た。

融点 = 66 ~ 68 °C

Rf 値 : 0.72 (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 1)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.89(3H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 1.31-2.05(14H, m), 2.34(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.87(2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 3.47(2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 3.47(2H, dt, $J=7.3\text{Hz}$, $J=9.7\text{Hz}$), 3.77(1H, m), 3.92(1H, dt, $J=7.3\text{Hz}$, $J=9.8\text{Hz}$), 4.58(1H, t, $J=3.9\text{Hz}$), 7.19(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.42(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 3273, 1655, 1599, 1033 cm^{-1}

MS (EI) : 333(M^+)

(3) 2-(4-(N-ヘプタノイル-N-メチルアミノ)フェニル)エトキシテトラヒドロピラン

エチレングリコールジメチルエーテル (120 ml) に上記化合物 (7.0 g) とカリウム-*t*-ブトキシド (5.18 g) を加え、30分間 60°C で攪拌した。これにヨウ化メチル (16.39 g) のエチレングリコールジメチルエーテル (4 ml) 溶液を滴下した。1時間 60°C で攪拌した後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 7) にて精製すると、標記化合物 (5.95 g) を得た。

Rf 値 : 0.23 (酢酸エチル : *n*-ヘキサン = 1 : 5)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.83(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.17-1.26(6H, m), 1.42-1.60(4H, m), 1.63-1.90(4H, m), 2.04(2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 3.47(2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 3.47(2H, dt, $J=7.3\text{Hz}$, $J=9.7\text{Hz}$), 3.77(1H, m), 3.92(1H, dt, $J=7.3\text{Hz}$, $J=9.8\text{Hz}$), 4.58(1H, t, $J=3.9\text{Hz}$), 7.19(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.42(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 3273, 1655, 1599, 1033 cm^{-1}

MS (EI) : 333(M^+)

(4) 2-(4-(N-ヘプチル-N-メチルアミノ)フェニル)エトキシテトラヒドロピラン

上記化合物 (5.95 g) のテトラヒドロフラン (90 ml) 溶液を 5°C に冷却し、これにジボラン-テトラヒドロフラン錯体 (テトラヒドロフラン 1 M 溶液 : 32.2 ml) を加え、 5°C で3時間攪拌した。メタノール (60 ml) を加え

た後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝１：７）にて精製すると、標記化合物（３．６ｇ）を得た。

Rf値：０．４９（酢酸エチル：n-ヘキサン＝１：２）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88(3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1.22-1.40(8H, m), 1.42-1.62(8H, m), 1.68-1.84(2H, m), 2.81(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.89(3H, s), 3.26(2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 3.46(1H, m), 3.57(1H, dt, $J=7.4\text{Hz}$, $J=7.8\text{Hz}$), 3.81(1H, m), 3.89(1H, dt, $J=7.3\text{Hz}$, $J=7.8\text{Hz}$), 4.60(1H, t, $J=3.0\text{Hz}$), 6.63(2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.08(2H, d, $J=8.8\text{Hz}$)

IR : 1616, 1365, 1030 cm^{-1}

MS (EI) : 333(M^+)

(5) 2-（４-（N-ヘプチル-N-メチルアミノ）フェニル）エチルアルコール

上記化合物（３．３６ｇ）のメタノール（６０ml）溶液にp-トルエンスルホン酸（３．１０ｇ）を加え、室温３時間攪拌した。トリエチルアミン（３ml）を加えた後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝１：１２）にて精製すると、標記化合物（３．２２ｇ）を得た。

Rf値：０．３１（メタノール：クロロホルム＝１：９）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88(3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.22-1.38(10H, m), 2.77(2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 2.90(3H, s), 3.27(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 3.80(1H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 6.66(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.08(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$)

IR : 3368, 1369 cm^{-1}

MS (EI) : 249(M^+)

(6) 2-（４-（N-ヘプチル-N-メチルアミノ）フェニル）エチルメタンスルホネート

上記化合物（３．６５ｇ）のテトラヒドロフラン（６０ml）溶液にトリエチ

ルアミン (2.22 g) を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロライド (3.01 g) を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1% 塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒: 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 5) にて精製すると、標記化合物 (4.02 g) を得た。

Rf 値: 0.56 (酢酸エチル: n-ヘキサン = 1: 5)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88(3H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 1.24-1.29(10H, m), 2.84(3H, s), 2.90(3H, s),
2.96(2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 3.27(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 4.36(2H, t, $J=6.9\text{Hz}$),
6.64(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.07(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

(7) 2-(4-(N-ヘプチル-N-メチルアミノ)フェニル)エチル ヨーダ
イド

上記化合物 (4.00 g) の2-ブタノン (200 ml) 溶液にヨウ化ナトリウム (3.66 g) を加え、2時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒: 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 10) にて精製すると、標記化合物 (2.58 g) を油状物として得た。

Rf 値: 0.78 (酢酸エチル: n-ヘキサン = 1: 10)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88(3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1.22-1.40(10H, m), 2.90(2H, s), 3.07(2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 3.63(2H, t, $J=5.9\text{Hz}$), 3.65(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 6.62(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.04(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR: 1614, 1521, 1371, 804 cm^{-1}

MS (EI): 359(M^+)

(8) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-(N-ヘプチル-N-メチルアミノ)フェニル)エチル マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル (4.63 g) に窒素気流下、ナトリウムエトキシド (1.54 g) の無水エタノール (18 ml) 溶液を滴下し、60℃で30分間攪拌した。次に、上記化合物 (18 g) のテトラヒドロフラン (7 ml) 溶液を滴下し、60℃で6時間攪拌する。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 2) にて精製すると、標記化合物 (1.92 g) を油状物として得た。

Rf 値: 0.49 (酢酸エチル: n-ヘキサン = 1: 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.23-1.29(10H, m), 1.24(6H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 1.99(3H, s), 2.38(2H, m), 2.63(2H, m), 2.88(3H, s), 3.25(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 4.21(4H, q, $J=7.4\text{Hz}$), 6.60(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 6.76(1H, br.s), 6.99(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR: 3285, 1739, 1682, 1616, 1371 cm^{-1}

MS (EI): 448(M^+)

(9) 1, 3-プロパンジイル-2-アセトアミド-2-[2-(4-(N-ヘプチル-N-メチルアミノ)フェニル)エチル]イリデンジアセテート

水素化アルミニウムリチウム (0.49 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (35 ml) に、窒素気流下、上記化合物 (1.92 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (20 ml) を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン (84 ml) を加えた。氷冷下、無水酢酸 (19 ml) を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル) にて精製すると、標記化合物 (1.2 g) を油状物として得た。

融点 = 88 ~ 94℃

Rf 値 : 0.50 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88(3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.24-1.29(10H, m), 1.94(3H, s), 2.08(6H, s),
2.15(2H, m), 2.51(2H, m), 2.89(3H, s), 3.26(2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 4.36(4H,
s), 5.60(1H, br.s), 6.63(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.03(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 3314, 1739, 1651, 1616, 1386 cm^{-1}

MS (EI) : 448(M^+)

(10) 2-アミノ-2-[2-(4-(N-ヘプチル-N-メチルアミノ)フェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール塩酸塩

上記化合物 (1.20 g) のメタノール (18 ml) - テトラヒドロフラン (18 ml) 溶液に水酸化リチウム (1.01 g) の水溶液 (12 ml) を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて再結晶した。得られた結晶のテトラヒドロフラン (7 ml) - メタノール (7 ml) 溶液に1M塩酸/エーテル溶液 (14 ml) を加えた。溶媒を留去し、析出した結晶を酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合物 (0.11 g) を得た。

融点 = 128 ~ 129 $^{\circ}\text{C}$

Rf 値 : 0.20 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.84(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.25-1.46(10H, m), 1.70-1.74(2H, m), 2.42-2.46
(2H, m), 2.81(3H, s), 3.23(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 3.49(4H, d, $J=5.3\text{Hz}$),
5.35 (2H, t, $J=4.9\text{Hz}$), 6.59(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 6.97(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 3277, 1610, 1514, 1248 cm^{-1}

MS (EI) : 322(M^+)

元素分析値 計算値 C:59.13, H:9.92, N:72.26 ($1.5\text{H}_2\text{O}$)

分析値 C:59.23, H:9.39, N:7.14

実施例 283 : 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプタノイルアミノフェニル)エ

チル] -1, 3-プロパンジオール

(1) 2-(4-ヘプタノイルアミノフェニル) エタノール

テトラヒドロフラン (300 ml) に 2-(p-アミノフェニル) エチルアルコール (13.8 g) とトリエチルアミン (10.8 g) を加え、氷冷下 30 分間攪拌した。これに塩化ヘプタノイル (15 g) を滴下し、氷冷下 30 分間攪拌した。さらに、室温で 3 時間攪拌した後、反応溶液を、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣について酢酸エチル-イソプロピルアルコールで再結晶することにより、標記化合物 (13.15 g) を得た。

融点 = 105 ~ 110 °C

Rf 値 : 0.41 (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 2 → 1 : 1)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.89(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.31-1.42(8H, m), 1.70(2H, tt, $J=7.3\text{Hz}$, $J=7.8\text{Hz}$), 2.35(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.83(2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 3.84(2H, dd, $J=6.3\text{Hz}$, $J=5.8\text{Hz}$), 7.12(1H, br.s), 7.18(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.45(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 3302, 1660, 1593, 1412 cm^{-1}

MS (EI) : 249(M^+)

元素分析値 計算値 C:70.97, H:9.33, N:5.52

分析値 C:71.30, H:9.26, N:5.66

(2) 2-(4-ヘプタノイルアミノフェニル) エチルメタンスルホネート

上記化合物 (6.00 g) のテトラヒドロフラン (100 ml) にトリエチルアミン (3.67 g) を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロライド (5.00 g) を滴下し、室温にて 2 時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1% 塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 : 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 1) にて精製すると、標記化合物 (6.02 g) を得た。

融点 = 103 ~ 105 °C

Rf 値 : 0.56 (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 5)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.89(3H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 1.22-1.40(6H, m), 1.72(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.35
(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.87(3H, s), 3.02(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 4.39(2H, t,
 $J=6.4\text{Hz}$), 7.13(1H, br.s), 7.19(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.48(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 3307, 1659, 1337 cm^{-1}

MS (EI) : 327(M^+)

元素分析値 計算値 C;70.97, H;9.33, N;5.52

分析値 C;71.30, H;9.26, N;5.66

(3) 2-(4-ヘプタノイルアミノフェニル)エチル ヨーダイド

上記化合物 (6.02 g) の 2-ブタノン (300 ml) 溶液にヨウ化ナトリウム (5.51 g) を加え、2時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 5) にて精製すると、標記化合物 (5.31 g) を油状物として得た。

融点 = 82 ~ 86 °C

Rf 値 : 0.33 (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 5)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87(3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.21-1.40(6H, m), 1.70(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.32
(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 3.12(2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 3.30(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 7.05
(1H, br.s), 7.12(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.44(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 3450, 1660, 1595, 709 cm^{-1}

MS (EI) : 359(M^+)

元素分析値 計算値 C;50.15, H;6.17, N;3.96

分析値 C;50.11, H;6.06, N;3.96

(4) ジエチル-2-第3級ブトキシカルボニルアミノ-2-(4-ヘプタノイル

アミノフェニル) エチル マロネート

2-第3級ブトキシカルボニルアミノマロン酸ジエチル (12.12 g) に窒素気流下、ナトリウムエトキシド (3.19 g) の無水エタノール (40 ml) 溶液を滴下し、50℃で30分間攪拌した。次に、上記化合物 (5.31 g) のテトラヒドロフラン (20 ml) 溶液を滴下し、60℃で5時間攪拌する。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=1:7) にて精製すると、標記化合物 (4.29 g) を得た。

Rf 値: 0.49 (酢酸エチル: n-ヘキサン=1:2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.82(3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.18(6H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.21-1.40(6H, m), 1.37(9H, s), 1.64(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 2.27(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.42(2H, m), 2.51(2H, m), 4.05-4.25(4H, m), 5.92(1H, br.s), 7.00(1H, br.s), 7.03(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.33(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR : 3319, 1739, 1772, 1666 cm^{-1}

MS (EI) : 506(M^+)

(5) 1, 3-プロパンジイル-2-第3級ブトキシカルボニルアミノ-2-[2-(4-ヘプタノイルアミノフェニル) エチル] イリデンジアセテート

窒素気流下、上記化合物 (4.29 g) のメタノール溶液に水素化ホウ素ナトリウム (0.32 g) を加え残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=2:1) にて精製すると、標記化合物 (0.56 g) を油状物として得た。

Rf 値: 0.31 (酢酸: n-ヘキサン=2:1)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.89(3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.21-1.46(10H, m), 1.45(9H, s), 1.70-1.90(4H, m), 2.34(2H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 2.59(2H, t, $J=8.7\text{Hz}$), 3.61-3.64(2H, m), 3.85-3.89(2H, m), 5.03(1H, br.s), 7.13(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.42(2H, d,

$J=8.3\text{Hz}$)

IR : 3310, 1668, 1602 cm^{-1}

MS (EI) : 422(M^+)

- (6) 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプタノイルアミノフェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール

上記化合物 (0.56 g) のトリフルオロ酢酸 (4 ml) 溶液を、氷冷下 4 時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、酢酸エチル (110 ml) を加え、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、メタノール-酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合物 (0.14 g) を白色結晶として得た。

融点 = 133~135°C

Rf 値 : 0.47 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1)

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ :

0.85(3H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 1.26-1.57(12H, m), 2.25(2H, t, $J=3.9\text{Hz}$), 3.17-3.25(4H, m), 4.43(2H, t, $J=4.9\text{Hz}$), 7.07(2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.45(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 9.73(1H, br. s),

IR : 3317, 1653, 1601 cm^{-1}

MS (EI) : 322(M^+)

元素分析値 計算値 C;67.05, H;9.38, N;8.69 ($1.5\text{H}_2\text{O}$)

分析値 C;66.95, H;9.08, N;8.25

- 実施例 284 : 2-アミノ-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール

- (1) 2-エトキシカルボニル-4-(4-オクチルフェニル)酪酸エチル

ナトリウム (2.67 g) を無水エタノール (100 ml) に溶解し、マロン酸ジエチル (18.6 g) を 27~30°C にて 3 分間滴下後、40°C で 40 分攪拌した。さらに、反応液に 2-(4-オクチルフェニル)エチルヨードライド (40 g) を 44~45°C にて 10 分間で滴下し、50°C、1 時間還流し、1.5 時間加熱攪拌した。反応液を冷却し、溶媒を減圧留去した後、水を加え、酢酸エチ

ルで抽出した。抽出液を水洗し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトに付し、標記化合物 28.8 g を得た。

IR : 2920, 2850, 1745, 1725, 1240, 1140, 1040 cm^{-1}

(2) 2-アミノ-2-エトキシカルボニル-4-(4-オクチルフェニル) 酪酸エチル

乾燥ジメチルホルムアミド (30 ml) に 60% 水素化ナトリウム (0.38 g) を懸濁させ、2-エトキシカルボニル-4-(4-オクチルフェニル) 酪酸エチル (3.0 g) を加えた後、室温にて 2 時間攪拌した。さらに、O-(2,4-ジニトロフェニル) ヒドロキシルアミン (1.14 g) を加え、室温にて 5 時間攪拌した後、冷水にあげ、トルエンにて抽出した。塩化ナトリウム水にて洗浄後、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を減圧留去して、標記化合物 3 g を得た。

IR : 3380, 3320, 2930, 2850, 1730, 1180 cm^{-1}

(3) 2-アミノ-2-[2-(4-オクチルフェニル) エチル]-1,3-プロパンジオール

水素化ホウ素ナトリウム (0.60 g) および臭化リチウム (1.66 g) のエタノール (17 ml) 懸濁液を室温にて 25 分間攪拌した。さらに、2-アミノ-2-エトキシカルボニル-4-(4-オクチルフェニル) 酪酸エチル (1.24 g) を 3 分間にて滴下し、室温にて 5 時間攪拌した。反応液に水 40 ml を加え、40 分間攪拌し、析出した結晶を濾取し、乾燥すると、標記化合物 0.68 g を得た。融点 : 125~126°C。標記化合物を塩酸エタノール液にて処理すると、対応する塩酸塩を得る。

実施例 285 : 2-アミノ-2-{2-[4-(7-オクテニルオキシ) フェニル] エチル}-1,3-プロパンジオール

(1) 2-[4-(7-オクテニルオキシ) フェニル] エチルアルコール

2-(4-ヒドロキシフェニル) エチルアルコール (8.68 g) の無水エタノール溶液 (240 ml) に、ナトリウムエトキシド (4.98 g) を加え、50°C で 30 分間攪拌した。次に 7-オクテニルブロマイド (10 g) の無水テト

ラヒドロフラン溶液を滴下し、50℃で6時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝1：5）にて精製すると、標記化合物（10.76g）を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO) :

1.35 (6H, s), 1.50~2.16 (4H, m), 2.62 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 3.41~3.65 (2H, m), 3.88 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.63 (1H, t, $J=5\text{Hz}$), 4.95 (2H, t \times t, $J=7\text{Hz}$, 2Hz), 5.66~5.96 (1H, m), 6.74 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.04 (2H, d, $J=9\text{Hz}$)

IR ν NEAT_{max} : 3445, 2251, 1028, 823, 761 cm^{-1}

MS 248 (M^+)

(2) 2-〔4-(7-オクテニルオキシ)フェニル〕エチル ヨーダイド

上記化合物（10.76g）のジクロロメタン溶液（100ml）に、トリエチルアミン（7.25ml）を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロライド（3.69ml）を滴下し、室温にて1時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣の2-ブタノン溶液（200ml）にヨウ化ナトリウム（7.78g）を加え、5時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝1：3）にて精製すると、標記化合物（13.72g）を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.53 (6H, s), 1.68~2.07 (4H, m), 2.96~3.18 (4H, m), 3.90 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.92 (2H, m), 5.56~5.96 (1H, m), 6.76 (2H, d, $J_{\text{H}}=9\text{Hz}$), 7.03 (2H, d, $J_{\text{H}}=9\text{Hz}$)

IR ν NEAT_{max} : 2930, 1511, 1246 cm^{-1}

MS 358 (M^+)

(3) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-(7-オクテニルオキシ)フェニル)エチル マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル (16.60 g) の無水エタノール溶液 (100 ml) に、ナトリウムエトキシド (5.72 g) を加え、65℃で30分攪拌した。次に上記化合物 (13.69 g) の無水エタノール溶液 (100 ml) を滴下し、65℃で3時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマト (展開溶媒: 酢酸エチル: ヘキサン = 1:2) にて精製すると、標記化合物 (4.60 g) を得た。

融点 = 50 ~ 53℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.25 (8H, t), 1.30 ~ 1.49 (6H, m), 1.72 ~ 1.79 (2H, m), 2.00 (3H, s), 2.63 ~ 2.67 (2H, m), 3.91 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.15 ~ 4.25 (4H, m), 4.92 ~ 5.03 (2H, m), 5.76 ~ 5.86 (1H, m), 6.79 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.04 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)

IR ν_{max} : 3251, 2931, 1743, 1515, 1247, 1186 cm^{-1}

MS 447 (M^+)

(4) 2-アセトアミド-2-[2-{4-(7-オクテニルオキシ)フェニル}エチル]-1,3-プロパンジオール ジアセテート

水素化アルミニウムリチウム (1.52 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (50 ml) に氷冷下、上記化合物 (4.47 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (70 ml) を滴下した。室温に戻し、3時間攪拌した。氷冷下、飽和硫酸ナトリウム水溶液を滴下し、水素化アルミニウムリチウムを分解後、濾別し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣にピリジン (19.8 ml) を加える。氷冷下、無水酢酸 (18.4 ml) を加え、室温で一夜放置した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を7%塩酸、飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲ

ルクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝１：２）にて精製し、標記化合物（２．２３ｇ）を白色結晶として得た。

融点＝８８～９０℃

MS ４４７（ M^+ ）

$^1\text{H-NMR}$ （ CDCl_3 ） δ ：

１．５４～１．５７（８Ｈ，ｍ），１．７６（２Ｈ，ｍ），１．９６（３Ｈ，ｓ），２．０３～２．０９（８Ｈ，ｍ），
２．５２～２．５７（２Ｈ，ｍ），３．９２（２Ｈ，ｔ， $J=6\text{Hz}$ ），４．３４（４Ｈ，ｓ），４．９３～５．０２
（２Ｈ，ｍ），５．６４（１Ｈ，ｓ），５．６４～５．８６（１Ｈ，ｍ），６．８１（２Ｈ，ｄ， $J=4\text{Hz}$ ），７．０
８（２Ｈ，ｄ， $J=4\text{Hz}$ ）

IR ν ： 3308, 1738, 1652, 1247, 1227 cm^{-1}

(5) ２－アミノ－２－〔２－〔４－（７－オクテニルオキシ）フェニル〕エチル〕
－１，３－プロパンジオール

上記化合物（１．０１ｇ）のメタノール溶液（２０ｍｌ）に水酸化リチウム（
０．８４ｇ）の水溶液（２０ｍｌ）を加え、２時間加熱還流した。反応液を濃縮
後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて
乾燥後、溶媒留去し、酢酸エチルにて再結晶することにより、融点 95～98℃
の標記化合物（０．３２ｇ）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ （ CDCl_3 ） δ ：

１．３６～１．４８（８Ｈ，ｍ），１．７３～１．７８（２Ｈ，ｍ），２．０６（２Ｈ，ｑ， $J=8\text{Hz}$ ），２．５９
（２Ｈ，ｔ， $J=8\text{Hz}$ ），３．５６（４Ｈ，ｑ， $J=12\text{Hz}$ ），３．９１（２Ｈ，ｑ， $J=8\text{Hz}$ ），４．９３～
５．０２（２Ｈ，ｍ），５．７６～５．８６（１Ｈ，ｍ），６．８２（２Ｈ，ｄ， $J=10\text{Hz}$ ），７．０９（２Ｈ，ｔ，
 $J=10\text{Hz}$ ）

IR ν ： 3350, 2938, 1512, 1245, 1021 cm^{-1}

実施例 286： ２－アミノ－２－〔２－（４－オクチルオキシフェニル）エチル〕
－１，３－プロパンジオール塩酸塩

(1) ２－アセトアミド－２－〔２－（４－オクチルオキシフェニル）エチル〕－
１，３－プロパンジオール ジアセテート

２－アセトアミド－２－〔２－〔４－（７－オクテニルオキシ）フェニル〕エ

チル} - 1, 3-プロパンジオール ジアセテート (1.27 g) のエタノール溶液 (30 ml) に 10% パラジウム炭素 (0.1 g) を加え、水素雰囲気下常温常圧で 6 時間攪拌した。触媒を濾別し、濾液を濃縮し、残渣を濾取し、標記化合物 (1.18 g) を得た。

融点 = 99 ~ 102 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ :

0.86 (3H, t, J=8Hz), 1.26 ~ 1.56 (12H, m), 1.94 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.12 ~ 2.17 (2H, m), 2.50 ~ 2.55 (2H, m), 3.89 (2H, t, J=6Hz), 4.32 (4H, s), 5.62 (1H, s), 6.79 (2H, d, J=8Hz), 7.06 (2H, d, J=8Hz)

IR ν : 3311, 2917, 1738, 1651, 1247 cm^{-1}

(2) 2-アミノ-2-{2-(4-オクチルオキシフェニル)エチル}-1, 3-プロパンジオール塩酸塩

上記化合物 (1.13 g) のエタノール溶液 (20 ml) に水酸化リチウム (0.94 g) の水溶液 (20 ml) を加え、3 時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をメタノール (10 ml) に溶かし、1 M 塩酸のエーテル溶液 (10 ml) を加える。析出する結晶を濾取し、表題化合物 (0.60 g, 65.2%) を得た。

融点 = 59 ~ 61 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ :

0.88 (3H, t, J=4Hz), 1.28 ~ 1.41 (12H, m), 1.73 ~ 1.75 (2H, m), 1.95 (2H, m), 2.60 (2H, s), 3.78 ~ 3.92 (6H, m), 6.80 (2H, m), 7.10 (2H, m)

IR ν : 3354, 1609, 1513, 1247

実施例 287 : 2-アミノ-2-(13-フェニルトリデシル)-1, 3-プロパンジオール

(1) 12-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)ドデカノール

1, 12-ドデカンジオール (25 g) をジクロロメタン (200 ml) とテ

トラヒドロフラン (200 ml) に溶解し、触媒量のパラトルエンスルホン酸と 3, 4-ジヒドロ-2H-ピラン (14 ml) を加えて、室温で2時間放置した。トリエチルアミンで反応を止めて、溶媒を留去後、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=1: 2) にて精製して、標記化合物 (15.46 g) を無色油状物質として得た。

Rf: 0.39 (酢酸エチル: ヘキサン=1: 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

1.28 (16H, m), 1.62 (10H, m), 3.65 (6H, m), 4.59 (1H, br.s)

IR (neat): 3417, 2927, 2854, 1034 cm^{-1}

MS (EI): 285 ($\text{M}^+ - 1$)

(2) 12-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) ドデカナール

ジメチルスルホキシド (11.3 ml) のジクロロメタン溶液 (85 ml) に、 -78°C で窒素雰囲気下、オキザリルクロリド (6.9 ml) をゆっくり滴下した。20分間、 -78°C で攪拌後、上記化合物 (15.25 g) のジクロロメタン 130 ml 溶液を30分間かけて徐々に加えた。20分間、 -78°C で攪拌後、トリエチルアミン (37 ml) を加えた。150 ml の水で反応を止めてクロロホルム 150 ml にて2回抽出後、乾燥、留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=1: 3) にて精製して、標記化合物 (13.54 g) をやや黄色の油状物質として得た。

Rf: 0.63 (酢酸エチル: ヘキサン=1: 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

1.29 (14H, m), 1.58 (10H, m), 2.43 (2H, dt, $J=2$ & 6Hz), 3.26~4.20

(4H, m), 4.59 (1H, br.s), 9.79 (1H, t, $J=2\text{Hz}$)

IR (neat): 2929, 2855, 1727 cm^{-1}

MS (EI): 284 (M^+)

(3) 1-フェニル-13-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)-1-トリデセン

ベンジルトリフェニルホスホニウムクロリド (19.44 g) のテトラヒドロ

フラン (100 ml) 懸濁液に 1.6 M ブチルリチウムのヘキサン溶液 (31 ml) を氷冷下加えた。これに、上記化合物 (13.54 g) のテトラヒドロフラン 30 ml 溶液を氷冷下滴下した。3 時間攪拌後、反応液を濃縮し、200 ml の氷水にあけた。酢酸エチル 150 ml にて 2 回抽出後、乾燥、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 9) にて精製して、標記化合物 (2.60 g) を得た。

R_f: 0.66 (酢酸エチル: ヘキサン = 1: 5)

¹H-NMR (CDCl₃/TMS) δ:

1.30 (14H, m), 1.58 (10H, m), 2.22 (2H, m), 3.60 & 3.80 (4H, 2m),
4.59 (1H, br.s), 6.19 ~ 6.53 (2H, m), 7.30 (5H, m)

IR (neat): 2927, 2854, 1466, 1034 cm⁻¹

MS (EI): 358 (M⁺)

(4) 13-フェニル-1-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)トリデカン
上記化合物 (2.63 g) のエタノール 80 ml 溶液に、10%パラジウム炭素 (260 mg) を加えて、水素雰囲気下、室温で 3 時間攪拌した。触媒をセライト濾過した後、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 9) にて精製して、標記化合物 (2.67 g) を無色油状物質として得た。

R_f: 0.60 (酢酸エチル: ヘキサン = 1: 5)

¹H-NMR (CDCl₃/TMS) δ:

1.27 (18H, m), 1.60 (10H, m), 2.62 (2H, t, J=7Hz), 3.45 & 3.80 (4H, 2m),
4.59 (1H, br.s), 7.21 (5H, m)

IR (neat): 2927, 2854, 1453 cm⁻¹

MS (EI): 360 (M⁺)

(5) 13-フェニルトリデカノール

上記化合物 (2.63 g) と触媒量の p-トルエンスルホン酸のメタノール (30 ml) およびテトラヒドロフラン (8 ml) 溶液を室温で一夜放置した。トリエチルアミン (0.5 ml) を加えて、濃縮後、得られた残渣をシリカゲルカ

ラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝１：５）にて精製して、標記化合物（１．７８ｇ）を白色結晶として得た。

融点＝３４～３６℃

Rf：０．２４（酢酸エチル：ヘキサン＝１：５）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 / TMS) δ :

1.28 & 1.57 (23H, 2br.s), 2.62 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 3.65 (2H, t, $J=6\text{Hz}$),
7.23 (5H, m)

IR (KBr) : 3344, 3259, 2918, 2848, 1468 cm^{-1}

MS (EI) : 276 (M^+)

(6) １３－フェニルトリデシルメタンスルホネート

上記化合物（１．７３ｇ）のジクロロメタン（３０ｍｌ）溶液にトリエチルアミン（１．２ｍｌ）を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロリド（０．５８ｍｌ）を滴下し、室温にて２時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、１％塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝１：５）にて精製すると、標記化合物（２．１２ｇ）を白色結晶として得た。

融点＝４５～４７℃

Rf：０．３９（酢酸エチル：ヘキサン＝１：１）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 / TMS) δ :

1.28 & 1.70 (22H, 2m), 2.62 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 3.01 (3H, s), 4.23 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 7.22 (5H, m)

IR (KBr) : 2920, 2851, 1474, 1344 cm^{-1}

MS (EI) : 354 (M^+)

元素分析値：計算値：C；６７．７５ H；９．６７

分析値：C；６７．７０ H；９．４８

(7) １３－フェニルトリデシルヨード

上記化合物（２．１２ｇ）の２－ブタノン（６０ｍｌ）溶液にヨウ化ナトリウ

ム (1. 165 g) を加え、2 時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=1: 9) にて精製すると、標記化合物 (2. 19 g) を白色結晶として得た。

融点=19~22°C

R_f: 0. 88 (酢酸エチル: ヘキサン=1: 2)

¹H-NMR (CDCl₃/TMS) δ:

1.27 & 1.70 (22H, 2m), 2.61 (2H, t, J=7.5Hz), 3.19 (2H, t, J=6.5Hz),
7.21 (5H, m)

IR (KBr): 2917, 2851, 1472 cm⁻¹

MS (EI): 386 (M⁺)

元素分析値: 計算値: C; 75. 63 H; 9. 91

分析値: C; 75. 22 H; 9. 92

(8) ジエチル 2-アセトアミド-2-(13-フェニルトリデシル) マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル (2. 38 g) に窒素気流下、ナトリウムエトキシド (0. 764 g) の無水エタノール (22 ml) 溶液を滴下し、65°Cで30分間攪拌した。次に、上記化合物 (2. 11 g) のテトラヒドロフラン (5 ml) 溶液を滴下し、65°Cで6時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン=1: 3) にて精製すると、標記化合物 (2. 06 g) を無色油状物質として得た。

R_f: 0. 41 (酢酸エチル: ヘキサン=1: 2)

¹H-NMR (CDCl₃/TMS) δ:

1.25 (20H, m), 1.58 (2H, m), 2.02 (3H, s), 2.30 (2H, m), 2.61 (2H, t, J=7.5Hz), 4.23 (4H, q, J=6Hz), 6.76 (1H, br.s), 7.21 (5H, m)

IR (neat) : 3416, 3312, 2925, 2854, 1741, 1671 cm^{-1}

MS (EI) : 475 (M^+)

(9) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(13-フェニルトリデシル)プロパン

水素化アルミニウムリチウム (0.56 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (40 ml) に、窒素気流下、上記化合物 (1.90 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (20 ml) を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン (8 ml) を加える。氷冷下、無水酢酸 (5 ml) を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷下、5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル) にて精製すると、標記化合物 (1.01 g) を白色結晶として得た。

融点 = 42 ~ 45 °C

Rf : 0.24 (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 1)

^1H -NMR (CDCl_3 / TMS) δ :

1.26 & 1.61 (22H, 2m), 1.96 (3H, s), 2.08 (6H, s), 2.62 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 4.30 (4H, s), 5.61 (1H, br.s), 7.21 (5H, m)

IR (KBr) : 3295, 2926, 2854, 1748, 1660, 1553 cm^{-1}

MS (EI) : 475 (M^+)

元素分析値 : 計算値 : C ; 70.70 H ; 9.54 N ; 2.94

分析値 : C ; 70.96 H ; 9.52 N ; 2.96

(10) 2-アミノ-2-(13-フェニルトリデシル)-1, 3-プロパンジオール・1/4水和物

上記化合物 (0.90 g) のメタノール (11.5 ml) 溶液に水酸化リチウム (0.88 g) の水溶液 (11.5 ml) を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて再結晶して、

標記化合物 (170 mg) を白色結晶として得た。

融点 = 61 ~ 64 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 / TMS) δ :

1.27 & 1.60 (24H, 2m), 2.00 (4H, m), 2.62 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 3.50 (4H, m), 7.22 (5H, m)

IR (KBr) : 3342, 3290, 3157, 2916, 2849, 1581, 1472 cm^{-1}

MS (EI) : 349 (M^+)

元素分析値 : 計算値 : C ; 74.63 H ; 11.24 N ; 3.96

分析値 : C ; 74.88 H ; 10.94 N ; 3.92

実施例 288 : 2-アミノ-2- {2- [4- (6-フェニルヘキシルオキシ)
フェニル] エチル} -1, 3-プロパンジオール

(1) 6-フェニルヘキシルメタンスルホネート

6-フェニルヘキサノール (5.0 g) のジクロロメタン (140 ml) 溶液にトリエチルアミン (5.09 ml) を加え、氷冷した。これにメタンスルホンクロリド (2.50 ml) を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 2) にて精製すると、標記化合物 (8.08 g) を無色油状物質として得た。

Rf : 0.45 (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 / TMS) δ :

1.15~1.95 (8H, m), 2.65 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.99 (3H, s), 4.22 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 7.22 (5H, m)

IR (neat) : 3027, 2937, 2858, 1497 cm^{-1}

(2) 6-フェニルヘキシルヨード

上記化合物 (7.93 g) の2-ブタノン (150 ml) 溶液にヨウ化ナトリウム (5.33 g) を加え、2時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチル

にて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝１：１９）にて精製すると、標記化合物（７．６２ｇ）を無色油状物として得た。

Rf : 0. 78 (酢酸エチル：ヘキサン＝１：５)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 / TMS) δ :

1.20~2.00 (8H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 3.17 (2H, t, $J=6.5\text{Hz}$),
7.15 (5H, m)

IR (neat) : 3026, 2930, 2855, 1496, 1453 cm^{-1}

MS (EI) : 288 (M^+)

(3) 2-〔4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル〕エタノール

エタノール (130ml) に 2-(4-ヒドロキシフェニル)エタノール (3.97g) とナトリウムエトキシド (2.30g) を加え、30分間加熱還流した。これに上記化合物 (7.53g) のテトラヒドロフラン (30ml) 溶液を滴下し、加熱還流下6時間攪拌した。反応溶液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン＝１：３）にて精製すると、標記化合物 (5.49g) を無色油状物質として得た。

Rf : 0. 50 (酢酸エチル：ヘキサン＝１：２)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 / TMS) δ :

1.24~1.89 (8H, m), 2.59 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.76 (2H, t, $J=5\text{Hz}$), 3.76
(2H, t, $J=6.5\text{Hz}$), 3.89 (2H, t, $J=5\text{Hz}$), 6.76 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.06
(2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.13 (5H, m)

IR (neat) : 3355, 2933, 2858, 1613, 1512 cm^{-1}

MS (EI) : 298 (M^+)

(4) 2-〔4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル〕エチルメタンサルホネート

上記化合物 (5.40 g) のジクロロメタン (100 ml) 溶液にトリエチルアミン (3.3 ml) を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロリド (1.7 ml) を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応溶液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 2) にて精製すると、標記化合物 (6.99 g) を無色油状物として得た。

Rf: 0.39 (酢酸エチル: ヘキサン = 1: 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 / TMS) δ :

1.30~1.92 (8H, m), 2.75 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.81 (3H, s), 2.96 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.89 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.33 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.80 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.06 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.15 (5H, m)

IR (neat): 2936, 2858, 1513 cm^{-1}

MS (EI): 376 (M^+)

(5) 2-[4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル]エチルヨードライド

上記化合物 (6.88 g) の2-ブタノン (180 ml) 溶液にヨウ化ナトリウム (3.29 g) を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 9) にて精製すると、標記化合物 (6.25 g) を無色油状物として得た。

Rf: 0.81 (酢酸エチル: ヘキサン = 1: 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 / TMS) δ :

1.18~1.92 (8H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 3.18 (4H, m), 3.90 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 6.75 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.06 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.10 (5H, m)

IR (neat): 2932, 2856, 1611, 1511 cm^{-1}

MS (EI): 408 (M^+)

元素分析値: 計算値: C; 58.83 H; 6.17

分析値：C；58.88 H；6.53

(6) ジエチル 2-アセトアミド-2-{2-[4-(6-フェニルヘキシル)フェニル]エチル} マロナート

アセトアミドマロン酸ジエチル (9.89 g) に窒素気流下、ナトリウムエトキシド (3.20 g) の無水エタノール (40 ml) 溶液を滴下し、65℃で30分間攪拌した。次に、上記化合物 (6.20 g) のテトラヒドロフラン (15 ml) 溶液を滴下し、65℃で6時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒；酢酸エチル：ヘキサン=1：3) にて精製すると、標記化合物 (4.04 g) を白色結晶として得た。

融点=53~55℃

R_f：0.18 (酢酸エチル：ヘキサン=1：2)

¹H-NMR (CDCl₃/TMS) δ：

1.84 (6H, t, J=7Hz), 1.11 ~ 1.88 (10H, m), 1.97 (3H, s), 2.24 ~ 2.76 (6H, m), 3.87 (2H, t, J=6Hz), 4.16 (4H, q, J=7Hz), 6.70 (1H, s), 6.74 (2H, d, J=8.5Hz), 6.97 (2H, d, J=8.5Hz), 7.15 (5H, m)

IR (neat)：3233, 2933, 1747, 1639, 1511 cm⁻¹

MS (EI)：497 (M⁺)

元素分析値：計算値：C；70.00 H；7.90 N；2.81

分析値：C；69.83 H；7.91 N；2.90

(7) 2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-{2-[4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル]エチル} プロパン

水素化アルミニウムリチウム (0.87 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (60 ml) に、窒素気流下、上記化合物 (3.79 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (10 ml) を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン (15 ml) を加える。氷冷下、無水酢酸 (10 ml)

を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷 5 % 塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒：酢酸エチル）にて精製すると、標記化合物（1.80 g）を白色結晶として得た。

融点 = 68 ~ 70 °C

R_f : 0.66 (酢酸エチル)

¹H-NMR (CDCl₃/TMS) δ :

1.24~1.88 (8H, m), 1.94 (3H, s), 2.06 (6H, s), 2.10 (2H, m), 2.56 (4H, m), 3.88 (2H, t, J=7Hz), 4.30 (4H, s), 5.60 (1H, s), 6.72 (2H, d, J=8.5Hz), 7.02 (2H, d, J=8.5Hz), 7.13 (5H, m)

IR (KBr) : 3319, 2934, 1739, 1652 cm⁻¹

MS (EI) : 497 (M⁺)

元素分析値：計算値：C ; 70.00 H ; 7.90 N ; 2.81

分析値：C ; 70.34 H ; 7.93 N ; 2.86

(8) 2-アミノ-2-{2-[4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル]エチル}-1,3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物（1.75 g）のメタノール（25 ml）溶液に水酸化リチウム（1.33 g）の水溶液（17 ml）を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて再結晶した。得られた結晶のメタノール（10 ml）溶液に1M塩酸のエーテル溶液（10 ml）を加える。溶媒を留去し、析出した結晶を酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合物（0.90 g）を白色結晶として得た。

融点 = 89 ~ 91 °C

R_f : 0.41 (クロロホルム：メタノール：酢酸：水 = 70 : 20 : 6 : 4)

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.33 (4H, m), 1.59 (6H, m), 1.91 (1H, br.s), 2.36 (1H, br.s), 2.55 (2H, t, J=7.8Hz), 3.72 (4H, m), 4.98 (1H, br.s), 6.66 (2H, d).

$J=8.8\text{Hz}$), 7.03 (2H, d, $J=8.8\text{Hz}$), 7.12 (3H, m), 7.22 (2H, m), 7.85 (1H, br. s)

IR (KBr) : 3275, 3028, 2934, 2858, 1513 cm^{-1}

MS (EI) : 371 (M^+)

元素分析値 : 計算値 : C ; 67.71 H ; 8.40 N ; 3.43

分析値 : C ; 67.61 H ; 8.30 N ; 3.42

実施例 289 : 2-アミノ-2-[2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール

(1) 2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エタノール

2-(4-ヒドロキシフェニル)エタノール (15.5 g)、ウンデシルブロミド 25 ml およびナトリウムエトキシド (8.40 g) のエタノール溶液 (300 ml) を 5 時間加熱還流した。溶媒留去後、水 (200 ml) と酢酸エチル (200 ml) を加える。水層をさらに酢酸エチル 200 ml にて抽出した。合わせた抽出物を乾燥、濾過後、溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 3) にて精製して、標記化合物 23.37 g を白色結晶として得た。

融点 = 47 ~ 50 °C

Rf : 0.40 (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 1.10 ~ 1.58 (16H, m), 1.87 (2H, m), 2.78 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 3.78 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.89 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.82 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.09 (2H, d, $J=9\text{Hz}$)

IR (KBr) : 3250, 2919, 2850, 1513, 1251 cm^{-1}

MS (EI) : 292 (M^+)

(2) 2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチルメタンスルホネート

上記化合物 (23.24 g) のジクロロメタン溶液 (400 ml) にトリエチルアミン (14.4 ml) を加えた。氷冷下、この混合物にメタンスルホニルクロリド (7.1 ml) を加えて、室温で 2 時間攪拌後、200 ml の氷水にあげ、

ジクロロメタン (200 ml) で2回抽出した。抽出物を乾燥、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン= 1: 3) にて精製して、標記化合物 (28.07 g) を白色結晶として得た。

融点= 43~44°C

Rf: 0.51 (酢酸エチル: ヘキサン= 1: 2)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.88 (3H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 1.25 (16H, m), 1.75 (2H, m), 2.81 (3H, s),
2.96 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.90 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.35 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.75
(2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.05 (2H, d, $J=9\text{Hz}$)

IR (KBr): 2919, 2851, 1515, 1352 cm^{-1}

MS (EI): 370 (M^+)

元素分析値: 計算値: C; 64.83 H; 9.25

分析値: C; 64.78 H; 9.17

(3) 2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチルヨードライド

上記化合物 (27.95 g) とヨウ化ナトリウム (13.00 g) の2-ブタノン溶液 (350 ml) を3時間加熱還流した。溶媒を留去後、水 (200 ml) を加え、酢酸エチル (200 ml) にて2回抽出後、乾燥した。溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン= 1: 19) にて精製して、標記化合物 (26.45 g) を白色結晶として得た。

融点= 22~23°C

Rf: 0.79 (酢酸エチル: ヘキサン= 1: 5)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /TMS) δ :

0.88 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.30 (16H, m), 1.75 (2H, m), 2.90~3.40 (4H, m),
3.90 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.76 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.02 (2H, d, $J=9\text{Hz}$),

IR (KBr): 2920, 2852, 1609, 1509, 1247 cm^{-1}

MS (EI): 402 (M^+)

(4) ジエチル2-アセトアミド-2-[2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチル]マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル (42.68 g) に窒素気流下、ナトリウムエトキシド (13.37 g) の無水エタノール (400 ml) 溶液を滴下し、65℃で30分間攪拌した。次に、上記化合物 (26.35 g) のテトラヒドロフラン (50 ml) 溶液を滴下し、65℃で6時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1:5) にて精製すると、標記化合物 (13.94 g) を得た。

融点 = 63 ~ 65℃

R_f: 0.24 (酢酸エチル: ヘキサン = 1:2)

¹H-NMR (CDCl₃ / TMS) δ:

0.86 (3H, t, J=7.1Hz), 1.24 (20H, m), 1.41 (2H, m), 1.73 (2H, m),
1.97 (3H, s), 2.39 (2H, m), 2.62 (2H, m), 3.89 (2H, t, J=6.3Hz), 4.18 (4H, m), 6.74 (1H, s), 6.77 (2H, d, J=8.3Hz), 7.02 (2H, d, J=8.3Hz)

IR (KBr): 3286, 2917, 2851, 1746, 1647, 1513 cm⁻¹

MS (EI): 491 (M⁺)

元素分析値: 計算値: C; 68.40 H; 9.22 N; 2.85

分析値: C; 68.15 H; 9.23 N; 2.80

(5) 2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチル)プロパン

水素化アルミニウムリチウム (3.0 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (200 ml) に、窒素気流下、上記化合物 (13.02 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (60 ml) を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え生成する水酸化アルミニウムを濾別後、溶媒を留去し、残渣にピリジン (40 ml) を加える。氷冷下、無水酢酸 (30 ml) を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸

エチル)にて精製すると、標記化合物 (7.18 g) を白色結晶として得た。

融点 = 82 ~ 85 °C

R_f : 0.6 (酢酸エチル)

¹H-NMR (CDCl₃ / TMS) δ :

0.86 (3H, t, J=6.4Hz), 1.24 (14H, m), 1.41 (2H, m), 1.75 (2H, m),
1.94 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.14 (2H, m), 2.53 (2H, m), 3.89 (2H, t,
J=6.6Hz), 4.32 (4H, s), 5.62 (1H, s), 6.79 (2H, d, J=8.8Hz), 7.06
(2H, d, J=8.8Hz)

I R (KBr) : 3314, 2918, 2851, 1737, 1653 cm⁻¹

MS (EI) : 491 (M⁺)

元素分析値 : 計算値 : C ; 68.40 H ; 9.22 N ; 2.85

分析値 : C ; 68.36 H ; 9.19 N ; 2.85

(6) 2-アミノ-2-[2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチル]-1,
3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物 (7.16 g) のメタノール (70 ml) 溶液に水酸化リチウム (5.50 g) の水溶液 (70 ml) を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、酢酸エチルにて再結晶した。得られた結晶のテトラヒドロフラン (20 ml) -メタノール (20 ml) 溶液に1M塩酸のエーテル溶液 (30 ml) を加える。溶媒を留去し、析出した結晶を酢酸エチルにて再結晶することによって、標記化合物 (1.90 g) を得た。

融点 = 88 ~ 91 °C

¹H-NMR (CDCl₃ - CD₃OD / TMS) δ :

0.80 (3H, t, J=6.9Hz), 1.19 (14H, m), 1.36 (2H, m), 1.68 (2H, m),
1.85 (2H, m), 2.53 (2H, m), 3.65 (4H, m), 3.84 (2H, t, J=6.4Hz),
6.74 (2H, d, J=8.3Hz), 7.04 (2H, d, J=8.3Hz)

I R (KBr) : 3274, 2921, 2852, 1613, 1513, 1247 cm⁻¹

MS (EI) : 365 (M⁺)

元素分析値：計算値：C；65.73 H；10.03 N；3.48

分析値：C；65.53 H；9.82 N；3.42

実施例290：2-アミノ-2-[2-(4-ドデシルフェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール

(1) 2-(4-ドデカノイルフェニル)エチルアセテート

ジクロロエタン(400ml)に窒素気流下、塩化アルミニウム(48.2g)を加え、室温で攪拌した。次にフェネチルアセテート(39.6g)およびウンデカノイルクロリド(52.7g)を氷冷下滴下し、室温で一晩攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテルにて抽出した。エーテル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒：酢酸エチル：ヘキサン=1:20)にて精製すると、標記化合物(34.5g)を淡黄色結晶として得た。

融点=32~33°C

IR(neat)_{max} : 2921, 2852, 1738, 1686, 1240 cm⁻¹

(2) 2-(4-ドデシルフェニル)エタノール

上記化合物(34.5g)のトリフルオロ酢酸溶液(50ml)に氷冷下、トリエチルシラン(22.7ml)を加え、室温にて3時間攪拌した。溶媒留去し、氷水を注ぎ、冷飽和重炭酸ナトリウム溶液を徐々に加える。酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。残渣にメタノール(250ml)を加え、メタノール溶液とした。これにナトリウムメトキシド(10.2g)を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水を注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を5%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、標記化合物(27.1g)を油状物として得る

Rf: 0.21 (酢酸エチル：ヘキサン=1:3)

(3) 2-(4-ドデシルフェニル)エチルヨードライド

上記化合物(27.1g)のジクロロメタン溶液(500ml)にトリエチルアミン(14.4ml)を加え、室温にて3時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、

ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム水溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣に2-ブタノン(500 ml)を加え、この溶液にヨウ化ナトリウム(12.2 g)を加え、3時間加熱還流した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒: 酢酸エチル: ヘキサン=1:20)にて精製すると、標記化合物(18.6 g)を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.37 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 0.66 ~ 0.86 (18H, m), 1.05 ~ 1.10 (2H, m), 2.06 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 2.63 (2H, t, $J=4\text{Hz}$), 2.83 (2H, t, $J=4\text{Hz}$), 6.60 (4H, dd, $J=4\text{Hz}$, 8Hz)

IR (neat) max : 2919, 1513, 1467, 1168 cm^{-1}

(4) ジエチル2-アセタミド-2-[2-(4-ドデシルフェニル)エチル]マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル(20.2 g)に窒素気流下、ナトリウムエトキシド(6.3 g)の無水エタノール溶液(100 ml)を滴下し、65°Cで30分攪拌した。次に、上記化合物(18.6 g)の無水テトラヒドロフラン溶液(50 ml)を滴下し、65°Cで3時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(展開溶媒: 酢酸エチル: ヘキサン=1:3)にて精製すると、標記化合物(8.9 g)を得た。

融点=60~62°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.24 (6H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.23~1.59 (18H, m), 1.54 ~ 1.59 (2H, m), 1.97 (3H, s), 2.45 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 2.54 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 2.67 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.15 ~ 4.24 (4H, m), 6.75 (1H, br.s), 7.06 (4H, dd, $J=6\text{Hz}$, 6Hz)

IR (KBr) max : 3253, 2920, 2850, 1747, 1644, 1517 cm^{-1}

(5) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(2-(4-ドデシルフェニル)エチル)プロパン

水素化アルミニウムリチウム (1.38 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (200 ml) に、窒素気流下、上記化合物 (8.9 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (50 ml) を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え、生成する水酸化アルミニウムを濾別後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣にピリジン (28.7 ml) を加える。氷冷下、無水酢酸 (18.5 ml) を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 2) にて精製し、標記化合物 (2.5 g) を白色結晶として得た。

融点 = 111 ~ 113 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.24 ~ 1.31 (18H, m), 1.53 ~ 1.58 (4H, m), 1.95 (3H, s), 2.09 (6H, s), 2.56 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 2.58 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.35 (4H, s), 5.62 (1H, br.s), 7.09 (4H, s)

IR (KBr) : 3309, 2918, 2850, 1738, 1651 cm^{-1}

(6) 2-アミノ-2-(2-(4-ドデシルフェニル)エチル)-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物 (2.5 g) のメタノール溶液 (25 ml) に水酸化リチウム (1.7 g) の水溶液 (25 ml) を加え、3時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、26%塩酸-エタノール溶液を加え、攪拌した。溶媒を留去し、エタノールにて再結晶し、標記化合物 (770 mg) を白色結晶として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO) δ :

0.88 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.25 ~ 1.30 (18H, m), 1.52 ~ 1.58 (2H, m), 1.94 ~ 2.02 (2H, m), 2.56 ~ 2.60 (2H, m), 2.64 ~ 2.68 (2H, m), 3.81 (4H, dd, $J=11, 26\text{Hz}$), 4.79 (2H, br.s), 7.09 (4H, dd, $J=6, 26\text{Hz}$), 8.07 (3H, br.s)

IR (KBr) : 2921, 2852, 1738, 1686, 1240 cm^{-1}

実施例 291 : 2-アミノ-2-[2-(2-オクチルフェニル)エチル]-1,3-プロパンジオール

(1) 1-(2-ブロモフェニル)オクタノール

無水テトラヒドロフラン (10 ml) に窒素気流下、マグネシウム片 (6.5 g) を加え、室温で攪拌した。次に、徐々に加熱しながら、1-ブロモヘプタン (48.4 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (200 ml) を滴下し、40 $^{\circ}\text{C}$ で1時間攪拌した。次に2-ブロモベンズアルデヒド (25 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (100 ml) を室温で滴下し、1時間攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 8) にて精製し、標記化合物 (18.9 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.24 ~ 1.58 (10H, m), 1.61 ~ 1.79 (2H, m), 5.05 (1H, m, $J=4\text{Hz}$), 7.08 ~ 7.12 (1H, m, $J=6\text{Hz}$), 7.29 ~ 7.31 (1H, m, $J=6\text{Hz}$), 7.50 ~ 7.54 (2H, m, $J=4\text{Hz}$)

IR ν (neat) : 3350, 2927, 1466, 1023 cm^{-1}

(2) トランス-2-(1-オクテニル)-ブロモベンゼン

上記化合物 (2.85 g) のベンゼン溶液 (200 ml) に五酸化二リン (7.1 g) を加え、2時間加熱還流した。五酸化二リンを濾別後、溶媒留去し、残渣に氷水を加えた。酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 15) にて精製し、標記化合物 (2.4 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.18 ~ 1.45 (6H, m), 1.46 ~ 1.55 (2H, m), 2.24 (2H, m, $J=1\text{Hz}$, 7Hz), 6.16 (1H, m, $J=7\text{Hz}$), 6.72 (1H, d, $J=16\text{Hz}$), 7.02 ~ 7.08 (1H, m), 7.19 ~ 7.33 (1H, m), 7.46 ~ 7.55 (2H, m)

$\text{IR}\nu$ (neat) : 2957, 2855, 1466, 1023 cm^{-1}

(3) トランス-2-(1-オクテニル)ベンズアルデヒド

無水テトラヒドロフラン (10 ml) に窒素気流下、マグネシウム片 (3.74 g) を加え、室温にて攪拌した。徐々に加熱しながら、上記化合物 (37.4 g) の無水テトラヒドロフラン (100 ml) を滴下し、60°C で1.5時間加熱した。次にジメチルホルムアミド (11.5 ml) の無水テトラヒドロフラン溶液 (100 ml) を室温で滴下し、一晩攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 15) にて精製し、標記化合物 (26.7 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.22 ~ 1.38 (6H, m), 1.45 ~ 1.52 (2H, m), 2.24 ~ 2.36 (2H, m), 6.11 ~ 6.18 (1H, m), 7.15 (1H, d, $J=18\text{Hz}$), 7.33 ~ 7.37 (1H, m), 7.48 ~ 7.53 (2H, m), 7.58 (1H, d, $J=4\text{Hz}$), 10.31 (1H, s)

$\text{IR}\nu$ (neat) : 2927, 2855, 1699, 1597 cm^{-1}

(4) 2-オクチルベンズアルデヒド

上記化合物 (26.7 g) のメタノール溶液 (200 ml) に10%パラジウム炭素 (1 g) のメタノール溶液 (20 ml) を加え、水素気流下、常温常圧にて14時間攪拌し、接触還元した。10%パラジウム炭素を濾別後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 20) にて精製し、標記化合物 (22 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.25 ~ 1.38 (10H, m), 1.54 ~ 1.63 (2H, m), 3.00

(2H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.24~7.26 (1H, m), 7.31~7.35 (1H, m), 7.46~7.50 (1H, m), 7.80~7.83 (1H, m), 10.28 (1H, s)

IR ν (neat) : 3335, 2926, 1701, 1601 cm^{-1}

(5) エチル (2-オクチルフェニル) アセテート

上記化合物 (22 g) のジオキサン溶液 (100 ml) に室温で、メチルメチルスルフィニルメチルスルフィド (12.4 g) およびトリトンB (9.16 ml) を加え、2時間加熱還流した。溶媒を留去し、酢酸エチルを加え、飽和食塩水にて酢酸エチル層を洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去し、残渣にエタノール (200 ml) を加えた。このものに、26%塩酸-エタノール溶液を加え、室温で30分間攪拌した。溶媒を留去し、残渣に氷水を注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で乾燥し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1:30) にて精製し、標記化合物 (20.2 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=5\text{Hz}$), 1.19~1.38 (10H, m), 1.24 (3H, t, $J=5\text{Hz}$), 1.49~1.62 (2H, m), 2.59 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 3.85 (2H, s), 4.13 (2H, q, $J=5\text{Hz}$), 7.10~7.35 (4H, m)

(6) 2-(2-オクチルフェニル) エチルアルコール

水素化アルミニウムリチウム (3.04 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (200 ml) に窒素気流下、上記化合物 (20.2 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (50 ml) を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え、生成する水酸化アルミニウムを濾別後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1:30) にて精製し、標記化合物 (10.2 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.21~1.46 (10H, m), 1.47~1.62 (2H, m), 2.61 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 2.96 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 3.82 (2H, dd, $J=6\text{Hz}$, 12Hz),

7.14~7.24 (4H, m)

IR (neat) : 3335, 2926, 2854, 1467 cm^{-1}

(7) 2-(2-オクチルフェニル)エチルメタンスルホネート

上記化合物 (10.2 g) のジクロロメタン溶液 (250 ml) に、トリエチルアミン (7.37 ml) を加え氷冷した。これにメタンスルホニルクロリド (6.04 g) を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム水溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 8) にて精製し、標記化合物 (13.4 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.22 ~ 1.41 (10H, m), 1.51 ~ 1.59 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 2.84 (3H, s), 3.09 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.38 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 7.10 ~ 7.20 (4H, m)

IR (neat) : 2929, 1467, 1357, 1174 cm^{-1}

(8) 2-(2-オクチルフェニル)エチルヨウダイド

上記化合物 (13.4 g) の2-ブタノン溶液 (300 ml) に、ヨウ化ナトリウム (7.7 g) を加え、2時間加熱還流した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 30) にて精製し、標記化合物 (11.9 g) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.18 ~ 1.74 (10H, m), 1.50 ~ 1.59 (2H, m), 2.57 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 3.18 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 3.28 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 7.10 ~ 7.25 (4H, m)

IR (neat) : 2923, 2854, 1490, 1468 cm^{-1}

(9) ジエチル 2-アセトアミド-2-[2-(2-オクチルフェニル)エチル]マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル (20.4 g) に窒素気流下、ナトリウムエトキシド (6.39 g) の無水エタノール溶液 (50 ml) を滴下し、65℃で1.5時間攪拌した。次に、上記化合物 (10.8 g) の無水テトラヒドロフラン溶液を滴下し、7時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 3) にて精製し、標記化合物 (5.8 g) を白色結晶として得た。

融点 = 37 ~ 38℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ :

0.86 (3H, t, J=6Hz), 1.21 ~ 1.36 (10H, m), 1.25 (6H, t, J=6Hz), 1.46 ~ 1.57 (2H, m), 2.03 (3H, s), 2.38 ~ 2.47 (2H, m), 2.51 (2H, t, J=6Hz), 2.55 ~ 2.63 (2H, m, J=6Hz), 4.16 ~ 4.41 (4H, m), 6.82 (2H, br.s), 7.05 ~ 7.15 (4H, m)

IR (KBr) : 3415, 2977, 2855, 1741, 1683, 1492 cm⁻¹

(10) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(2-オクチルフェニル)エチル]プロパン

水素化アルミニウムリチウム (0.76 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (200 ml) に窒素気流下、上記化合物 (4.3 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (50 ml) を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液に飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え、生成する水酸化アルミニウムを濾別後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣にピリジン (10 ml) を加えた。次に無水酢酸 (13 ml) を加え、室温で一晩放置した。反応液を氷冷5%塩酸に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル: ヘキサン = 1: 3) にて精製し、標記化合物 (2.2 g) を油状物で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ :

0.86 (3H, t, J=6Hz), 1.21 ~ 1.38 (12H, m), 1.47 ~ 1.58 (2H, m), 1.97

(3H, s), 2.08 (6H, s), 2.56 (2H, t, J=6Hz), 2.58 (2H, t, J=6Hz),
4.35 (4H, s), 5.66 (1H, br.s), 7.09 ~ 7.13 (4H, m)

IR (neat) : 3295, 2927, 1747, 1660, 1256 cm^{-1}

(11) 2-アミノ-2-[2-(2-オクチルフェニル)エチル]-1,3-プロ
パンジオール・塩酸塩

上記化合物 (2.2 g) のメタノール溶液 (20 ml) に水酸化リチウム (1.7 g) の水溶液 (20 ml) を加え、4 時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣に 26% 塩酸-エタノール溶液を加え、溶媒留去し、エタノールから再結晶することにより標記化合物 (800 mg) の塩酸塩を得た。

融点 = 168 ~ 170 °C

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO) δ :

0.85 (3H, t, J=7Hz), 1.22 ~ 1.37 (10H, m), 1.43 ~ 1.54 (2H, m), 1.68 ~ 1.78 (2H, m), 2.52 ~ 2.63 (4H, m), 3.49 ~ 3.59 (4H, m), 5.40 (2H, t, J=4Hz), 7.05 ~ 7.17 (4H, m), 7.89 (3H, br.s)

IR ν (KBr) : 3385, 3272, 2925, 1519, 1069 cm^{-1}

実施例 292: 2-アミノ-2-(4-オクチルチオベンジル)-1,3-プロ
パンジオール・塩酸塩・1/2 水和物

(1) 4-(メチルチオ)ベンジルアルコール

イソプロピルアルコール (50 ml) に水素化ホウ素ナトリウム (3.78 g) を加え、氷冷下攪拌した。これに 4-(メチルチオ)ベンズアルデヒド (15 g) を滴下し、室温で 30 分間攪拌した。溶媒留去後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をヘキサン-酢酸エチルから再結晶し、標記化合物 (15 g) を白色結晶として得た。

融点 = 41 ~ 43 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ :

2.40 (3H, s), 4.43 (2H, s), 7.10 (4H, s), 3.36 (1H, br.s)

元素分析値($C_8H_{10}OS$) : 計算値 : C, 62.30; H, 6.54

分析値 : C, 61.90; H, 6.55

MS : 154 (M^+)

(2) 4-(メチルスルフィニル)ベンジルアルコール

上記化合物 (15 g) のクロロホルム溶液 (100 ml) に氷冷下メタクロロ過安息香酸 (50%含有, 35 g) を加え、1時間加撈拌した。水酸化カルシウム (37 g) を加え、室温にて1時間撈拌した後、不溶物を濾別し、濾液を飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; クロロホルム: メタノール = 20 : 1) にて精製し、標記化合物 (15.56 g) を油状物として得た。

1H -NMR ($CDCl_3$) δ :

2.73 (3H, s), 3.28 (1H, br. s), 4.45 (2H, s), 7.52 (4H, s)

IR (neat) : 3364, 1409, 1303, 1148, 1031 cm^{-1}

元素分析値($C_8H_{10}O_2S$) : 計算値 : C, 56.45; H, 5.92

分析値 : C, 56.51; H, 5.87

MS : 170 (M^+)

(3) 4-(メチルスルフィニル)ベンジルメタンスルホナート

上記化合物 (13.88 g) のジクロロメタン溶液 (100 ml) に氷冷下トリエチルアミン (14 ml) を加えた。これにメタンスルフォニルクロリド (6.2 ml) を滴下し、30分間撈拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、0.1N塩酸および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; クロロホルム: メタノール = 10 : 1) にて精製し、標記化合物 (15.38 g) を白色結晶として得た。

融点 : 63~65 $^{\circ}C$

1H -NMR ($CDCl_3$) δ :

2.74 (3H, s), 3.0 (3H, s), 5.22 (2H, s), 7.52 (2H, d, $J=8Hz$), 7.63 (2H, d, $J=8Hz$)

IR (KBr) : 3015, 1349, 1172, 1040, 951 cm^{-1}

元素分析値($\text{C}_9\text{H}_{12}\text{O}_4\text{S}_2$) : 計算値 : C, 43.53; H, 4.87

分析値 : C, 43.51; H, 4.82

MS : 248 (M^+)

(4) 4-(メチルスルフィニル)ベンジルヨード

上記化合物 (8.25 g) の2-ブタノン溶液 (100 ml) にヨウ化ナトリウム (7.5 g) を加え、室温にて1時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; クロロホルム: メタノール = 10:1) にて精製し、標記化合物 (8.65 g) を黄色結晶として得た。

融点 : 80~81 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

2.70 (3H, s), 4.42 (3H, s), 7.50 (4H, s)

IR (KBr) : 1399, 1153, 1038, 837, 565 cm^{-1}

元素分析値($\text{C}_8\text{H}_9\text{OSI}$) : 計算値 : C, 34.30; H, 3.24

分析値 : C, 34.17; H, 3.21

MS : 280 (M^+)

(5) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-メチルスルフィニルベンジル) マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル (1.3 g) の無水エタノール溶液 (200 ml) に窒素気流下、ナトリウムエトキシド (4 g) を加え、65 $^{\circ}\text{C}$ で1時間攪拌した。次に、上記化合物 (8.4 g) の無水エタノール溶液を滴下し、65 $^{\circ}\text{C}$ で1時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; クロロホルム: メタノール = 20:1) にて精製し、標記化合物 (8.2 g) を結晶として得た。

融点 : 135~136 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.28 (6H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.02 (3H, s), 2.70 (3H, s), 3.70 (2H, s), 4.25 (4H, m), 6.52 (1H, s), 7.15 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.53 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)

IR (KBr) : 3253, 2986, 1748, 1642, 1198, 1039 cm^{-1}

元素分析値($\text{C}_{17}\text{H}_{23}\text{NO}_6\text{S}$) : 計算値 : C, 55.27; H, 6.27; N, 3.79

分析値 : C, 55.09; H, 6.25; N, 3.78

(6) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-メルカプトベンジル) マロネート

上記化合物 (6.22 g) を氷冷下、トリフルオロ酢酸無水物 (50 ml) に加え、1時間攪拌した。トリフルオロ酢酸無水物を留去後、エタノール (100 ml) とトリエチルアミン (100 ml) を加え、室温にて1時間攪拌した。反応液を濃縮後、クロロホルム 200 ml を加え、飽和塩化アンモニウム水溶液にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 : クロロホルム : メタノール = 10 : 1) にて精製し、標記化合物 (4.62 g) を結晶として得た。

融点 : 125 ~ 128 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.27 (6H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.00 (3H, s), 3.38 (1H, s), 3.57 (2H, s), 4.24 (4H, m), 6.50 (1H, s), 6.85 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.14 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)

IR (KBr) : 3398, 2986, 2547, 1736, 1665, 1212, 1018 cm^{-1}

元素分析値($\text{C}_{16}\text{H}_{21}\text{NO}_5\text{S}$) : 計算値 : C, 56.62; H, 6.24; N, 4.13

分析値 : C, 56.61; H, 6.20; N, 4.09

MS : 339 (M^+)

(7) ジエチル 2-アセトアミド-2-(4-オクチルチオベンジル) マロネート

上記化合物 (1 g) のジメチルホルムアミド溶液 (10 ml) に、1-ブロモオクタン (0.58 g) と炭酸カリウム (0.5 g) を加え、室温にて5時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得ら

れた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；クロロホルム：メタノール＝25：1）にて精製し、標記化合物（1.16 g）を結晶として得た。

融点：82～84℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.27 (14H, m), 1.40 (2H, quint, $J=7\text{Hz}$), 1.61 (2H, quint, $J=7\text{Hz}$), 2.01 (3H, s), 2.86 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.58 (2H, s), 4.25 (4H, m), 6.51 (1H, s), 6.89 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.17 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)

I R (KBr) : 3255, 2952, 1747, 1644, 1298, 1274, 1220 cm^{-1}

元素分析値($\text{C}_{24}\text{H}_{37}\text{NO}_6\text{S}$) : 計算値 : C, 63.83; H, 8.26; N, 3.10

分析値 : C, 63.33; H, 8.14; N, 3.06

MS : 451 (M^+)

(8) 2-アセトアミド-2-(4-オクチルチオベンジル)-1,3-プロパンジオール

水素化アルミニウムリチウム（0.26 g）の無水テトラヒドロフラン溶液（10 ml）に氷冷下、上記化合物（1 g）の無水テトラヒドロフラン溶液（10 ml）を滴下した。氷冷下で1時間攪拌した後、室温で1時間攪拌した。氷冷下、飽和硫酸ナトリウム水溶液を滴下し、水素化アルミニウムリチウムを分解後、不溶物を濾別し、濾液を酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（展開溶媒；クロロホルム：メタノール＝10：1）にて精製し、標記化合物（0.6 g）を結晶として得た。

融点：76～78℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.25 (8H, m), 1.40 (2H, quint, $J=7\text{Hz}$), 1.61 (2H, quint, $J=7\text{Hz}$), 1.99 (3H, s), 2.87 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.89 (2H, s), 3.50 (2H, m), 3.70 (2H, m), 3.73 (2H, m, $-\text{OH} \times 2$), 5.79 (1H, s, $-\text{NH}$), 7.14 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.25 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)

I R (KBr) : 3422, 3347, 3192, 2942, 1654, 1550, 1055 cm^{-1}

元素分析値($C_{20}H_{23}NO_3S$) : 計算値 : C, 65.36; H, 9.05; N, 3.81

分析値 : C, 65.29; H, 9.11; N, 3.75

MS : 367 (M^+)

(9) 2-アミノ-2-(4-オクチルチオベンジル)-1,3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物(400mg)のメタノール溶液(5ml)に水酸化リチウム(380mg)の水溶液(5ml)を加え、4時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去すると白色粉末が得られた。このものを、エタノール(2ml)に溶解し、26%塩酸-エタノール溶液(1ml)を加えた。溶媒を留去し、析出する結晶をヘキサン-酢酸エチルから再結晶することによって、標記化合物(80mg)を得た。

融点 : 100~102°C

1H -NMR (CD_3OD) δ :

0.76 (3H, t, $J=7Hz$), 1.16 (8H, m), 1.30 (2H, m), 1.53 (2H, quint, $J=7Hz$), 2.79 (2H, t, $J=7Hz$), 2.86 (2H, s), 3.43 (2H, m), 3.62 (3H, m), 7.06 (2H, d, $J=8Hz$), 7.15 (2H, d, $J=8Hz$)

IR (KBr) : 3363, 3286, 2924, 1516, 1494, 1072 cm^{-1}

元素分析値($C_{18}H_{21}NO_2S \cdot HCl \cdot 1/2H_2O$) :

計算値 : C, 58.28; H, 8.97; N, 3.78

分析値 : C, 58.44; H, 9.02; N, 3.68

実施例 293 : 2-アミノ-2-[2-(5-オクチル-2-チエニル)エチル]-1,3-プロパンジオール塩酸塩

(1) 2-(2-チエニルエチル)-2-テトラヒドロピラニルエーテル

2-(2-チエニル)エタノール(12.85g)のジクロロメタン溶液(100ml)に、3,4-ジヒドロ-2H-ピラン(9.25g)とp-トルエンスルホン酸(2g)を加え、室温にて4時間攪拌した。溶媒を留去後、酢酸エチルを加え、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、

得られた油状物を蒸留により精製すると、標記化合物 (13.52 g) を油状物として得た。

沸点 = 107 ~ 108 °C / 1 mmHg

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

1.50 (4H, m), 1.70 (1H, m), 1.82 (1H, m), 3.11 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.47 (1H, m), 3.60 (1H, dt, $J=10, 7\text{Hz}$), 3.79 (1H, m), 3.95 (1H, dt, $J=10, 7\text{Hz}$), 4.61 (1H, t, $J=3.5\text{Hz}$), 6.83 (1H, dd, $J=1, 3.4\text{Hz}$), 6.90 (1H, dd, $J=3.4, 5.4\text{Hz}$), 7.11 (1H, dd, $J=1, 5.4\text{Hz}$)

IR (neat) : 2930, 1250, 1120, 1030, 870 cm^{-1}

元素分析値 $\text{C}_{11}\text{H}_{16}\text{O}_2\text{S}$: 計算値 : C ; 62.23 H ; 7.60

分析値 : C ; 62.83 H ; 7.01

MS : 212 (M^+)

(2) 2-(5-オクチル-2-チエニル)エチル 2-テトラヒドロピラニルエーテル

上記化合物 (8.5 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (100 ml) を -78 °C に冷却し、 n -ブチルリチウムのヘキサン溶液 (1.63 mol/l, 30 ml) を滴下した。氷冷下にて、30 分間攪拌した後、室温で 30 分間攪拌した。1-ブロモオクタン (10 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (15 ml) を滴下し、室温にて 7 時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; ヘキサン : 酢酸エチル = 20 : 1) にて精製すると、標記化合物 (6.6 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t, 7Hz), 1.25 (10H, m), 1.53 (4H, m), 1.62 (2H, m), 1.72 (1H, m), 1.83 (1H, m), 2.71 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.02 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.46 (1H, m), 3.60 (1H, dt, $J=10, 7\text{Hz}$), 3.80 (1H, m), 3.92 (1H, dt, $J=10, 7\text{Hz}$), 4.61 (1H, t, $J=3.5\text{Hz}$), 6.54 (1H, d, $J=3.4\text{Hz}$), 6.61 (1H,

d, $J=3.4\text{Hz}$)

IR (neat) : 2927, 2854, 1135, 1120, 1033 cm^{-1}

元素分析値 $\text{C}_{19}\text{H}_{32}\text{O}_2\text{S}$: 計算値 : C ; 70.32 H ; 9.94

分析値 : C ; 70.12 H ; 10.03

MS : 324 (M^+)

(3) 2-(5-オクチル-2-チエニル)エタノール

上記化合物 (6.5 g) のメタノール溶液 (80 ml) に、テトラヒドロフラン (20 ml) と p-トルエンスルホン酸 (0.3 g) を加え、室温にて1時間攪拌した。溶媒を留去後、酢酸エチルを加え、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; ヘキサン : 酢酸エチル = 5 : 1) にて精製すると、標記化合物 (4 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.27 (10H, m), 1.62 (2H, quint, $J=7\text{Hz}$), 2.73 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.00 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 3.80 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 6.58 (1H, d, $J=3.4\text{Hz}$), 6.64 (1H, d, $J=3.4\text{Hz}$)

IR (neat) : 3348, 2927, 2854, 1466, 1047, 797 cm^{-1}

元素分析値 $\text{C}_{14}\text{H}_{24}\text{OS} \cdot 0.1\text{H}_2\text{O}$: 計算値 : C ; 69.43 H ; 10.07

分析値 : C ; 69.34 H ; 10.17

MS : 240 (M^+)

(4) 2-(5-オクチル-2-チエニル)エチル メタンスルホネート

上記化合物 (4 g) のジクロロメタン溶液 (50 ml) に氷冷下トリエチルアミン (3 ml) を加える。これに、メタンスルホンクロリド (1.5 ml) を滴下し、30分間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、0.1 N塩酸および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; クロロホルム : メタノール = 20 : 1) にて精製すると、標記化合物 (5 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.27 (10H, m), 1.61 (2H, quint, $J=7\text{Hz}$), 2.72 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 2.91 (3H, s), 3.17 (2H, t, $J=3.4\text{Hz}$), 4.37 (2H, t, $J=6.5\text{Hz}$), 6.58 (1H, d, $J=3.4\text{Hz}$), 6.67 (1H, d, $J=3.4\text{Hz}$)

I R (n e a t) : 2927, 2854, 1357, 1176, 959, 802 cm^{-1}

元素分析値 $\text{C}_{15}\text{H}_{26}\text{O}_3\text{S}_2$: 計算値 : C ; 56.57 H ; 8.23

分析値 : C ; 56.19 H ; 8.10

MS : 318 (M^+)

(5) 2-(5-オクチル-2-チエニル)エチルヨード

上記化合物 (4.8 g) の2-ブタノン溶液 (50 ml) にヨウ化ナトリウム (4.5 g) を加え、室温にて17時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; ヘキサン : 酢酸エチル = 20 : 1) にて精製すると、標記化合物 (4.9 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.28 (10H, m), 1.62 (2H, quint, $J=7\text{Hz}$), 2.72 (2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 3.30 (4H, m), 6.57 (1H, d, $J=3.4\text{Hz}$), 6.63 (1H, d, $J=3.4\text{Hz}$)

I R (n e a t) : 2926, 2853, 1466, 1168, 796 cm^{-1}

元素分析値 $\text{C}_{14}\text{H}_{23}\text{SI}$: 計算値 : C ; 48.00 H ; 6.62

分析値 : C ; 48.29 H ; 6.99

MS : 350 (M^+)

(6) ジエチル 2-アセトアミド-2-[2-(5-オクチル-2-チエニル)エチル]マロネート

無水ジメチルホルムアミド (20 ml) に60%油性水素化ナトリウム (0.33 g) を懸濁し、これにアセトアミドマロン酸ジエチル (1.82 g) を加え、室温にて1時間攪拌した。次に上記化合物 (2.7 g) の無水ジメチルホルムア

ミド溶液 (10 ml) を滴下し、室温で 10 時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) にて精製すると、標記化合物 (1.4 g) を結晶として得た。

融点 = 5.7 ~ 5.8 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.25 (16H, m), 1.57 (2H, quint, $J=7\text{Hz}$), 2.0 (3H, s), 2.61 (2H, m), 2.70 (4H, m), 4.20 (4H, m), 6.52 (1H, d, $J=3.4\text{Hz}$), 6.53 (1H, d, $J=3.4\text{Hz}$), 6.75 (1H, s)

IR (neat) : 3278, 2923, 2852, 1746, 1647, 1211, 1195 cm^{-1}

元素分析値 $\text{C}_{23}\text{H}_{37}\text{NO}_5\text{S}$: 計算値 : C; 62.84 H; 8.48 N; 3.19

分析値 : C; 62.80 H; 8.42 N; 2.94

MS : 439 (M^+)

(7) 2-アセトアミド-2-[2-(5-オクチル-2-チエニル)エチル]-1,3-プロパンジオール

水素化アルミニウムリチウム (0.38 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (15 ml) に氷冷下、上記化合物 (1.3 g) の無水テトラヒドロフラン溶液 (15 ml) を滴下した。氷冷下で 1 時間攪拌した後、室温で 1 時間攪拌した。氷冷下、飽和硫酸ナトリウム水溶液を滴下し、水素化アルミニウムリチウムを分解後、不溶物を濾別し、濾液を酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; クロロホルム: メタノール = 15 : 1) にて精製し、標記化合物 (0.5 g) を結晶として得た。

融点 = 5.8 ~ 6.0 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.27 (10H, m), 1.60 (2H, m), 1.94 (3H, s), 2.02 (2H, m), 2.71 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.82 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.57 (2H, dd, $J=6$,

12Hz), 3.71 (2H, br. s, OH×2), 3.80 (2H, dd, J=6, 12Hz), 5.88 (1H, s), 6.54 (1H, d, J=3.4Hz), 6.58 (1H, d, J=3.4Hz)

I R (K B r) : 3277, 2924, 2852, 1626, 1560, 1236, 1064, 1036 cm^{-1}

元素分析値 $\text{C}_{19}\text{H}_{33}\text{NO}_3\text{S}$: 計算値 : C; 64.19 H; 9.36 N; 3.94

分析値 : C; 63.75 H; 9.17 N; 3.68

MS : 355 (M^+)

(8) 2-アミノ-2-[2-(5-オクチル-2-チエニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物 (500 mg) のメタノール溶液 (5 ml) に水酸化リチウム (380 mg) の水溶液 (5 ml) を加え、5時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去すると粉末が得られる。このものをエタノール (3 ml) に溶解し、26%塩酸のエタノール溶液 (2 ml) を加える。溶媒を留去し、析出する結晶をヘキサン-酢酸エチルから再結晶することによって、標記化合物 (150 mg) を得た。

融点 = 63 ~ 65 °C

^1H -NMR (CD_3OD) δ :

0.79 (3H, t, J=7Hz), 1.18 (10H, m), 1.53 (2H, m), 1.96 (2H, m), 2.63 (2H, t, J=7.5Hz), 2.74 (2H, m), 3.61 (2H, d, J=12.2Hz), 3.67 (2H, d, J=12.2Hz), 6.47 (1H, d, J=3.4Hz), 6.54 (1H, d, J=3.4Hz)

I R (K B r) : 3482, 3265, 1631, 1530, 1468, 1059, 811 cm^{-1}

元素分析値 $\text{C}_{17}\text{H}_{31}\text{NO}_2\text{S} \cdot \text{HCl}$: 計算値 : C; 58.35 H; 9.22 N; 4.00

分析値 : C; 58.12 H; 9.25 N; 4.03

MS : 313 (M^+)

実施例 294 : 2-アミノ-2-(4-オクチルスルフィニルベンジル)-1, 3-プロパンジオール

(1) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシー-2-(4-オクチルチオベンジル)プロパン

2-アセトアミド-2-(4-オクチルチオベンジル)-1,3-プロパンジオール (1.04 g) のピリジン溶液 (30 ml) に無水酢酸 (0.67 ml) を加え、室温で4時間攪拌した。反応液を濃縮後、5%塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; 酢酸エチル:ヘキサン=4:1) にて精製し、標記化合物 (0.73 g) を得た。

融点 = 71 ~ 74 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.10 ~ 1.85 (12H, m), 1.94 (3H, s), 2.06 (6H, s), 2.28 (2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 3.19 (2H, s), 4.26 (4H, dd, $J=11.2, 17.6\text{Hz}$), 5.48 (1H, br.s), 7.03 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.20 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR (KBr) : 3295, 2924, 1739 cm^{-1}

MS : 451 (M^+)

元素分析値 : 計算値 : C; 63.83 H; 8.26 N; 3.10

分析値 : C; 64.00 H; 8.32 N; 3.12

(2) 2-アセトアミド-1,3-ジアセトキシ-2-(4-オクチルスルフィニルベンジル)プロパン

上記化合物 (0.73 g) のクロロホルム溶液 (15 ml) に、氷冷下、メタクロル過安息香酸 (0.56 g) を加え、40分間攪拌した。反応液に水酸化カルシウム (0.23 g) を加え、室温で1時間攪拌した後、不溶物を濾去し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; ジクロロメタン:メタノール=30:1) にて精製し、標記化合物 (0.66 g) を得た。

融点 = 70 ~ 72 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1.10 ~ 1.80 (12H, m), 1.95 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.76 (2H, m), 3.33 (2H, s), 4.09 ~ 4.16 (4H, m), 5.54 (1H, s), 7.29 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.54 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

IR (KBr) : 3278, 3081, 2928, 1746, 1672, 1218 cm^{-1}

MS : 467 (M^+)

元素分析値 : 計算値 : C; 61.65 H; 7.97 N; 3.00

分析値 : C; 61.36 H; 7.90 N; 2.93

(3) 2-アミノ-2-(4-オクチルスルフィニルベンジル)-1, 3-プロパンジオール

上記化合物 (300 mg) のメタノール溶液 (3 ml) に水酸化リチウム (242 mg) の水溶液 (3 ml) を加え、50℃で5時間攪拌した。反応液を濃縮後、酢酸エチルにて抽出し、水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、酢酸エチル-ヘキサンから再結晶することにより、標記化合物 (81.5 mg) を得た。

融点 = 80 ~ 82℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.20 ~ 1.80 (16H, m), 2.70 ~ 2.90 (4H, m),
3.44 (4H, dd, $J=10.3, 17.1\text{Hz}$), 7.38 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$)

IR (KBr) : 3339, 2915, 2758, 1033 cm^{-1}

MS : 342 (M^+)

元素分析値 : 計算値 : C; 63.31 H; 9.15 N; 4.10

分析値 : C; 62.62 H; 9.04 N; 3.91

実施例 295 : 2-アミノ-2-(4-オクチルスルホニルベンジル)-1, 3-プロパンジオール

(1) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(4-オクチルスルホニルベンジル) プロパン

2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(4-オクチルスルフィニルベンジル) プロパン (330 mg) のクロロホルム溶液 (10 ml) に、氷冷下、メタクロル過安息香酸 (244 mg) を加え、2.5時間攪拌し、さらに室温で1.5時間攪拌した。反応液に水酸化カルシウム (0.1 g) を加え、室温で45分攪拌した後、不溶物を濾去し、濾液を減圧下濃縮した。残渣をヘキサン-酢

酸エチルから再結晶することにより標記化合物 (162 mg) を得た。

融点 = 98 ~ 100 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.84 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1.10 ~ 1.80 (12H, m), 1.96 (3H, s), 2.07 (6H, s), 3.06 (2H, m), 3.38 (2H, s), 4.25 (4H, dd, $J=11.7, 25.8\text{Hz}$), 5.54 (1H, s), 7.34 (2H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.81 (2H, d, $J=8.2\text{Hz}$)

IR (KBr) : 3317, 2921, 2853, 1749, 1654, 1313, 1141 cm^{-1}

MS : 483 (M^+)

元素分析値 : 計算値 : C; 59.61 H; 7.71 N; 2.90

分析値 : C; 59.50 H; 7.60 N; 2.85

(2) 2-アミノ-2-(4-オクチルスルホニルベンジル)-1,3-プロパンジオール

上記化合物 (140 mg) のメタノール溶液 (2.5 ml) に水酸化リチウム (109 mg) の水溶液 (2.5 ml) を加え、50 °C で4時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで抽出し、水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、ヘキサノン-酢酸エチルにて再結晶することにより標記化合物 (45 mg) を得た。

融点 = 108 ~ 109 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.84 (3H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 1.10 ~ 1.86 (16H, m), 2.83 (2H, s), 3.06 (2H, m), 3.43 (2H, s), 3.44 (2H, s), 7.43 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.82 (2H, d, $J=7.8\text{Hz}$)

IR (KBr) : 3343, 2915, 1299, 1147 cm^{-1}

MS : 357 (M^+)

元素分析値 : 計算値 ($0.1\text{H}_2\text{O}$) : C; 60.17 H; 8.75 N; 3.90

分析値 : C; 59.89 H; 8.79 N; 3.91

実施例 296 : 2-アミノ-2-[2-(3-オクチルフェニル)エチル] 1,3-プロパンジオールおよびその塩酸塩

(1) 1-(3-ブロモフェニル)オクタノール

マグネシウム (9.8 g) の無水テトラヒドロフラン (100 ml) 溶液に、少量のヨウ素を加え、ヨウ素の色が消えるまで 50 °C で攪拌した。これに、ヘプチルブロマイドの無水テトラヒドロフラン (200 ml) 溶液を 1 時間で滴下した。さらに 65 °C で 1 時間攪拌した後、m-ブロモベンズアルデヒドの無水テトラヒドロフラン (200 ml) 溶液を氷冷下で滴下し、室温で 30 分攪拌した。氷冷下、飽和塩化アンモニア水 (7.3 ml) を加え、1 時間攪拌した。不溶物を濾過し、濾液を濃縮後、酢酸エチルに溶解し、水で洗浄した。硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 10 : 1) にて精製すると、標記化合物 (50.9 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.20 ~ 1.90 (13H, m), 4.61 (1H, m), 7.1 ~ 7.3 (2H, m), 7.36 (1H, dt, $J=1.5, 7.8\text{Hz}$), 7.49 (1H, m)

IR (neat) : 3346, 2922, 2853 cm^{-1}

MS : 285 (M^+)

元素分析値 : 計算値 : C; 58.96 H; 7.42 N; 0.00

分析値 : C; 58.92 H; 7.36 N; 0.00

(2) トランス-1-(3-ブロモフェニル)-1-オクテン

上記化合物 (10 g) のベンゼン (500 ml) 溶液に、五酸化リン (24.9 g) を加え、1.5 時間、加熱還流した。不溶物を濾過し、濾液を水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 20 : 1) にて精製すると、標記化合物 (9 g) を油状物質として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88 (3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.20 ~ 1.50 (8H, m), 2.19 (2H, dt, $J=6.3, 6.5\text{Hz}$), 6.21 (1H, td, $J=6.3, 16.1\text{Hz}$), 6.28 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 7.13 (1H, t, $J=7.9\text{Hz}$), 7.21 (1H, m), 7.28 (1H, m), 7.47 (1H, m)

IR (neat) : 3439, 3063 cm^{-1}

MS : 267 (M^+)

(3) トランス-1-(3-ホルミルフェニル)-1-オクテン

マグネシウム (1.38 g) の無水テトラヒドロフラン (30 ml) 溶液に、少量のヨウ素を加え、ヨウ素の色が消えるまで 50℃ で攪拌した。これに上記化合物 (13.8 g) の無水テトラヒドロフラン (40 ml) 溶液を 30 分間で滴下した。さらに、55℃、1 時間攪拌した後、室温でジメチルホルムアミド (4 ml) の無水テトラヒドロフラン (30 ml) 溶液を 1 時間で滴下し、室温で 2 時間攪拌した。氷冷下、飽和塩化アンモニウム水を注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; ヘキサン : 酢酸エチル = 30 : 1) にて精製すると、標記化合物 (7.12 g) を油状物質として得た。

^1H -NMR (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.20 ~ 1.60 (8H, m), 2.22 (2H, dt, $J=6.8, 6.9\text{Hz}$), 6.32 (1H, td, $J=6.8, 15.7\text{Hz}$), 6.41 (1H, d, $J=15.7\text{Hz}$), 7.43 (1H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 7.57 (1H, m), 7.68 (1H, m), 7.83 (1H, s), 9.99 (1H, s)

IR (neat) : 2956, 2927, 2855, 1699 cm^{-1}

MS : 216 (M^+)

元素分析値 : 計算値 : C; 83.29 H; 9.32

分析値 : C; 83.50 H; 9.29

(4) 3-(トランス-1-オクテニル)- β -メチルスルフィニル- β -メチルチオスチレン

上記化合物 (6.17 g) のジオキサン (30 ml) 溶液に、メチルメチルスルフィニルメチルスルフィド (3 ml) およびトリメチルベンジルアンモニウムヒドロキシドのメタノール溶液 (2.6 ml) を加え、80℃ で 2 時間攪拌した。反応液を濃縮後、酢酸エチルに溶解し、水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; ヘキサン : 酢酸エチル = 4 : 1) にて精製すると、標記化合物 (6.48 g) を油状物質

として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.20 ~1.55 (8H, m), 2.12 (2H, dt, $J=6.8, 6.9\text{Hz}$), 2.30 (3H, s), 2.75 (3H, s), 6.25 (1H, td, $J=6.8, 16.1\text{Hz}$), 6.37 (3H, t, $J=16.1\text{Hz}$), 7.30 ~7.40 (2H, m), 7.60 (1H, s), 7.72 (1H, m), 7.81 (1H, s)

IR (neat) : 2955, 2925, 1068 cm^{-1}

MS : 322 (M^+)

(5) エチル 3- (トランス-1-オクテニル) フェニルアセテート

上記化合物 (6.48 g) のエタノール (40 ml) 溶液に 26% 塩化水素のエタノール (48 ml) を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; ヘキサン : 酢酸エチル = 20 : 1) にて精製すると、標記化合物 (5.11 g) を油状物質として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.18 ~1.50 (11H, m), 2.19 (2H, dt, $J=6.8, 6.9\text{Hz}$), 3.57 (2H, s), 4.13 (2H, q, $J=7.3\text{Hz}$), 6.22 (1H, td, $J=6.8, 16.1\text{Hz}$), 6.33 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 7.10 ~7.25 (4H, m)

IR (neat) : 2957, 2927, 2855, 1737 cm^{-1}

MS : 274 (M^+)

(6) 2- [3- (トランス-1-オクテニル) フェニル] エタノール

水素化アルミニウムリチウム (1.22 g) を無水テトラヒドロフラン (150 ml) に懸濁し、この中に氷冷下上記化合物 (5.89 g) を加え、1 時間攪拌した。氷冷下、エタノール、水を加え、不溶物を濾別し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; ヘキサン : 酢酸エチル = 5 : 1) にて精製することにより、標記化合物 (4.22 g) を油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.10 ~1.50 (8H, m), 2.19 (2H, dt, $J=6.8, 6.9$

Hz), 2.83 (2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 3.85 (2H, dt, $J=6.2, 6.3\text{Hz}$), 6.20 (1H, td, $J=6.8, 16.1\text{Hz}$), 6.34 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 7.03 (1H, m), 7.18~7.27 (3H, m)

IR (neat) : 3348, 2956, 2926, 2854 cm^{-1}

MS : 232 (M^+)

(7) 2-〔3-(トランス-1-オクテニル)フェニル〕エチルメタンスルホネート

上記化合物 (4.19 g) のジクロロメタン溶液 (60 ml) に、トリエチルアミン (2.8 ml) を加え、氷冷した。これにメタンスルホニルクロリド (14 ml) を滴下し、室温にて1.5時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジクロロメタンにて抽出した。ジクロロメタン層を飽和重炭酸カリウム溶液、1%塩酸水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 5 : 1) にて精製すると、標記化合物 (5.55 g) を油状物質として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.20 ~ 1.50 (8H, m), 2.19 (2H, dt, $J=6.8, 6.9\text{Hz}$), 2.83 (3H, s), 3.02 (2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 4.40 (2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 6.22 (1H, td, $J=6.8, 15.6\text{Hz}$), 6.33 (1H, d, $J=15.6\text{Hz}$), 7.03 (1H, m), 7.18~7.24 (3H, m)

IR (neat) : 2956, 2927, 2855 cm^{-1}

MS : 310 (M^+)

(8) 2-〔3-(トランス-1-オクテニル)フェニル〕エチルヨードライド

上記化合物 (5.51 g) の2-ブタノン (60 ml) 溶液にヨウ化ナトリウム (3.99 g) を加え、45°C、3時間攪拌した。反応液を濃縮後、氷水中に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル = 100 : 1) にて精製すると、標記化合物 (4.75 g) を油状物質として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.20 ~ 1.50 (8H, m), 2.19 (2H, dt, $J=6.8, 6.9\text{Hz}$), 3.14 (2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 3.34 (2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 6.21 (1H, td, $J=6.8, 18.1\text{Hz}$), 6.34 (1H, d, $J=18.1\text{Hz}$), 7.00 (1H, m), 7.14~7.24 (3H, m)

IR (neat) : 2956, 2925, 2853 cm^{-1}

MS : 342 (M^+)

(9) ジエチル 2-アセトアミド-2-[2-[3-(トランス-1-オクテニル)フェニル)エチル]マロネート

アセトアミドマロン酸ジエチル (7.62 g) のエタノール (30 ml) 溶液にナトリウムエトキシド (7.62 g) を加え、60°C で 45 分間攪拌した。次に、上記化合物 (4 g) のエタノール (20 ml) 溶液を滴下し、5 時間加熱還流した。反応液を濃縮後、氷水に注ぎ酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒 ; ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) にて精製すると、標記化合物 (2.46 g) を油状物質として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.22 (6H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.22~1.50 (8H, m), 1.97 (3H, s), 2.17 (2H, dt, $J=6.8, 6.9\text{Hz}$), 2.43 (2H, m), 2.67 (2H, m), 4.11~4.23 (4H, m), 6.18 (1H, td, $J=6.8, 16.1\text{Hz}$), 6.31 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 6.74 (1H, s), 6.94 (1H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 7.09~7.18 (3H, m)

IR (neat) : 3413, 2957, 2927, 1741, 1683 cm^{-1}

MS : 431 (M^+)

元素分析値 : 計算値(1/10 H_2O) : C; 69.29 H; 8.65 N; 3.23

分析値 : C; 69.04 H; 8.75 N; 3.26

(10) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(3-(トランス-1-オクテニル)フェニル)エチル]プロパン

水素化アルミニウムリチウム (0.74 g) の無水テトラヒドロフラン (40

m 1) 溶液に、窒素気流下、上記化合物 (2. 8 g) の無水テトラヒドロフラン (20 m l) を氷冷下滴下し、室温で2時間攪拌した。氷冷下、反応液にエタノールおよび水を加え、不溶物を濾別後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、溶媒を留去すると、黄色油状物質 (2. 34 g) を得た。これをピリジン (60 m l) に溶解し、氷冷下、無水酢酸 (1. 6 m l) を加え、室温で2. 5時間攪拌した。反応液を濃縮後、残渣を酢酸エチルに溶解し、飽和塩化アンモニウム水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル= 4 : 1) にて精製することにより、標記化合物 (1. 8 g) を白色結晶として得た。

融点= 84 ~ 86 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.87 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.10 ~ 1.50 (8H, m), 1.94 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.15 ~ 2.21 (4H, m), 2.57 (2H, m), 4.33 (4H, s), 5.62 (1H, s), 6.19 (1H, dt, $J=6.8, 16.1\text{Hz}$), 6.33 (1H, d, $J=16.1\text{Hz}$), 6.99 (1H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 7.13 ~ 7.21 (3H, m)

IR (KBr) : 3311, 2961, 2926, 1738, 1652 cm^{-1}

MS : 431 (M^+)

元素分析値 : 計算値 : C; 69.58 H; 8.64 N; 3.25

分析値 : C; 69.85 H; 8.74 N; 3.35

(11) 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-〔2-(3-オクチルフェニル)エチル〕プロパン

上記化合物 (1. 41 g) のメタノール (10 m l) 溶液に10%パラジウム炭素 (150 m g) を懸濁したメタノール (10 m l) 溶液を加え、水素加圧 (10気圧) 下2時間攪拌した。反応容器を窒素置換した後、不溶物を濾別し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル= 2 : 1) にて精製することにより、標記化合物 (1. 05 g) を白色結晶として得た。

融点= 86 ~ 87 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.10 ~ 1.60 (12H, m), 1.93 (3H, s), 2.07 (6H, s), 2.18 (2H, m), 2.52 (2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 2.56 (2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 4.33 (4H, s), 5.61 (1H, s), 6.95 ~ 7.05 (3H, m), 7.17 (1H, t, $J=7.8\text{Hz}$)

IR (KBr) : 3313, 2960, 2925, 2854, 1738, 1651 cm^{-1}

(12) 2-アミノ-2-[2-(3-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

上記化合物 (1.04 g) のメタノール (10 ml) 溶液に水酸化リチウム (1 g) の水溶液 (10 ml) を加え、5 時間加熱還流した。反応液を濃縮後、酢酸エチルに抽出し、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、シリカゲルカラムクロマト (展開溶媒; クロロホルム: メタノール = 5 : 1) にて精製することにより、標記化合物 (0.46 g) を白色結晶として得た。

融点 = 89 ~ 92 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.85 (3H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 1.20 ~ 1.35 (12H, m), 1.55 (2H, m), 1.83 (2H, m), 2.51 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 2.60 (2H, m), 2.98 (2H, br.s), 3.68 (2H, t, $J=11.2\text{Hz}$), 3.71 (2H, t, $J=11.2\text{Hz}$), 6.97 (3H, m), 7.12 (1H, t, $J=7.3\text{Hz}$)

IR (KBr) : 3396, 3257, 2925, 2854 cm^{-1}

(13) 2-アミノ-2-[3-(3-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩

上記化合物 (0.45 g) をエタノール (20 ml) に溶解し、26% 塩酸のエタノール溶液 (1 ml) を加えた。溶媒を留去し、析出する結晶を再結晶 (酢酸エチル: メタノール = 30 : 1) することにより、標記化合物 (0.33 g) を得た。

融点 = 99 ~ 101 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO) δ :

0.84 (3H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 1.20 ~ 1.35 (12H, m), 1.53 (2H, m), 1.74 (2H, m), 2.40 ~ 2.60 (2H, m), 3.45 (4H, s), 5.33 (2H, br.s), 6.98 ~ 7.00 (3H, m), 7.18 (1H, t, $J=7.3\text{Hz}$), 7.70 (3H, br.s)

IR (KBr) : 3178, 2924, 2853 cm^{-1}

実施例 297 : 2-アミノ-2-(4-デシルフェニル)-1, 3-プロパンジオール

(1) 4-ブロモメチルデシルベンゼン

4-デシルフェニルメタノール (3.91 g) をトルエン (40 ml) に溶解し、48%臭化水素酸 (40 ml) を加え、90℃で6時間加熱攪拌した。冷後有機相を分離し、飽和食塩水、重炭酸ナトリウム溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、油状の標記化合物 (4.9 g) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.86 (3H, t, $J=6.6\text{Hz}$), 1.2 ~ 1.3 (14H, m), 1.5 ~ 1.6 (2H, m), 2.57 (2H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 4.47 (2H, s), 7.13 (2H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.28 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$)

(2) 4-デシルフェニルニトロメタン

亜硝酸銀 (4.15 g)、乾燥エーテル (20 ml) をフラスコに入れ、氷冷した。攪拌下、4-ブロモメチルデシルベンゼン (5.5 g) のエーテル (10 ml) 溶液を滴下した。滴下終了後、氷冷下に4時間攪拌し、不溶物を濾別した。濾液の溶媒を留去し、ペンタンから結晶化すると、淡黄色結晶として標記化合物 (1.44 g) を得た。

融点 = 50℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.2 ~ 1.3 (14H, m), 1.5 ~ 1.6 (2H, m), 2.62 (2H, t, $J=8\text{Hz}$), 5.41 (2H, s), 7.24 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.28 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)

(3) 2-(4-デシルフェニル)-2-ニトロ-1, 3-プロパンジオール

4-デシルフェニルニトロメタン (555 mg) をエタノール (5 ml) に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液 (0.02 ml) と37%ホルマリン (0.

45 ml)を加え、50℃で6時間加熱した。溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、ヘキサンから結晶化し、無色鱗片状の標記化合物(1.75 g)を得た。

融点=80~81℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.2~1.3 (14H, m), 1.5~1.6 (2H, m), 2.59 (2H, t, $J=8\text{Hz}$), 2.77 (2H, m), 4.35 (2H, m), 4.60 (2H, m), 7.17 (2H, d, $J=10\text{Hz}$), 7.21 (2H, d, $J=10\text{Hz}$)

(4) 2-アミノ-2-(4-デシルフェニル)-1, 3-プロパンジオール

2-(4-デシルフェニル)-2-ニトロ-1, 3-プロパンジオール(170 mg)をエタノール(30 ml)に溶解し、5%パラジウム炭素(40 mg)の存在下、水素圧20気圧にて接触還元反応を行った。8時間攪拌後、不溶物を濾別し、濾液を濃縮した。残渣を分取薄層クロマトグラフ(シリカゲル)で精製し、標記化合物(8.9 mg)を得た。

融点=136~137℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 - CD_3OD) δ :

0.88 (3H, t, $J=8\text{Hz}$), 1.1~1.4 (14H, m), 1.4~1.8 (2H, m), 2.3~2.7 (6H, m), 3.5~4.2 (4H, m), 7.2 (2H, d, $J=10\text{Hz}$), 7.33 (2H, d, $J=10\text{Hz}$)

塩酸塩の融点=113~114℃(イソプロピルアルコールから再結晶)

実施例298: 2-アセチルアミノ-2-(4-デシルフェニル)-1, 3-プロパンジオール

2-アミノ-2-(4-デシルフェニル)-1, 3-プロパンジオール(313 mg)をエタノール(20 ml)およびクロロホルム(5 ml)混合溶媒に溶解し、トリエチルアミン(0.4 ml)を加え、ドライアイス-メタノールで-60℃に冷却した。これにアセチルクロリド(0.12 ml)のジクロロメタン(5 ml)溶液を冷却下、滴下した後室温にもどした。溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルに溶解し、食塩水、希塩酸水、重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去し、残渣を分取薄層クロマトグラフィー(

シリカゲル)で精製し、ヘキサンから再結晶し、無色結晶の標記化合物(130 mg)を得た。

融点 = 112 ~ 113 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88 (3H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 1.2~1.4 (14H, m), 1.5 ~ 1.7 (2H, m), 2.17 (3H, s), 2.58 (2H, t, $J=7.9\text{Hz}$), 3.66 (2H, dd, $J=7.7\text{Hz}$, 6Hz), 3.88 (2H, dd, $J=12\text{Hz}$, 7.6Hz), 4.05 (2H, dd, $J=11.9\text{Hz}$, 6Hz), 6.37 (1H, bs), 7.20 (2H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.25 (2H, d, $J=8.6\text{Hz}$)

実施例 299 : 5-アセトアミド-5-(4-デシルフェニル)-2,2-ジメチル-1,3-ジオキサン

2-アセチルアミノ-2-(4-デシルフェニル)-1,3-プロパンジオール(224 mg)、2,2-ジメトキシプロパン(0.3 ml)をベンゼン(5 ml)に溶解し、触媒量のトルエンスルホン酸存在下、加熱還流した。冷後、重炭酸ナトリウム水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、残渣を分取薄層クロマトグラフィー(シリカゲル)で精製し、アモルファス晶の標記化合物(99 mg)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ :

0.88 (3H, t, $J=6.6\text{Hz}$), 1.2~1.4 (14H, m), 1.48 (3H, s), 1.51 (3H, s), 1.5 ~ 1.7 (2H, m), 2.06 (3H, s), 2.56 (2H, t, $J=7.8\text{Hz}$), 4.14 (4H, s), 6.23 (1H, bs), 7.15 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 7.22 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)

実施例 300 : 2-アミノ-2-(8-フェニルオクチル)-1,3-プロパンジオール

実施例 301 : 2-アミノ-2-(9-フェニルノニル)-1,3-プロパンジオール

実施例 302 : 2-アミノ-2-(11-フェニルウンデシル)-1,3-プロパンジオール

実施例 303 : 2-アミノ-2-(12-フェニルドデシル)-1,3-プロパンジオール

- 実施例 304 : 2-アミノ-2-(14-フェニルテトラデシル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 305 : 2-アミノ-2-(15-フェニルペンタデシル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 306 : 2-アミノ-2-(16-フェニルヘキサデシル)-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 307 : 2-アミノ-2-[2-(4-トリデシルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 308 : 2-アミノ-2-[2-(4-テトラデシルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 309 : 2-アミノ-2-[2-(4-ヘキシルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 310 : 2-アミノ-2-[2-(4-デシルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 311 : 2-アミノ-2-[2-(4-ドデシルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 312 : 2-アミノ-2-[2-(4-トリデシルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 313 : 2-アミノ-2-[2-(4-(8-フルオロオクチル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 314 : 2-アミノ-2-[2-(4-(12-フルオロドデシル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 315 : 2-アミノ-2-[2-(4-(7-フルオロヘプチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 316 : 2-アミノ-2-[2-(4-(11-フルオロウンデシルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 317 : 2-アミノ-2-[2-(4-フェニルメチルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

- 実施例 3 1 8 : 2-アミノ-2-[2-(4-(2-フェニルエチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 1 9 : 2-アミノ-2-[2-(4-(3-フェニルプロピルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 2 0 : 2-アミノ-2-[2-(4-(4-フェニルブチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 2 1 : 2-アミノ-2-[2-(4-(5-フェニルペンチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 2 2 : 2-アミノ-2-[2-(4-(7-フェニルヘプチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 2 3 : 2-アミノ-2-[2-(4-(8-フェニルオクチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 2 4 : 2-アミノ-2-[4-(6-(4-フルオロフェニル)ヘキシルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 2 5 : 2-アミノ-2-[2-(4-(4-フェノキシブチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 2 6 : 2-アミノ-2-[2-(4-(5-フェノキシペンチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 2 7 : 2-アミノ-2-[2-(4-(6-フェノキシヘキシルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 2 8 : 2-アミノ-2-[2-(4-(7-フェノキシヘプチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 2 9 : 2-アミノ-2-[2-(4-(4-フェノキシブチル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 3 0 : 2-アミノ-2-[2-(4-(5-フェノキシペンチル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 3 1 : 2-アミノ-2-[2-(4-(6-フェノキシヘキシル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

- 実施例 3 3 2 : 2-アミノ-2-[2-(4-(7-フェノキシヘプチル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 3 3 : 2-アミノ-2-[2-(4-オクチルシクロヘキシル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 3 4 : 2-アミノ-2-[2-(4-ノニルシクロヘキシル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 3 5 : 2-アミノ-2-[2-(4-ドデシルシクロヘキシル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 3 6 : 2-アミノ-2-[2-(1-オクチルピペリジン-4-イル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 3 7 : 2-アミノ-2-[2-(1-ドデシルピペリジン-4-イル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 3 8 : 2-アミノ-2-[2-(5-ノニル-2-チエニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 3 9 : 2-アミノ-2-[2-(5-デシル-2-チエニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 4 0 : 2-アミノ-2-[2-(5-ドデシル-2-チエニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 4 1 : 2-アミノ-2-[1,3-(2-チエニル)トリデシル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 4 2 : 2-アミノ-2-[2-(5-オクチル-2-ピリジル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 4 3 : 2-アミノ-2-[2-(5-デシル-2-ピリジル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 4 4 : 2-アミノ-2-[1,3-(2-ピリジル)トリデシル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 4 5 : 2-アミノ-2-[2-(2-オクチル-5-ピリジル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

- 実施例 3 4 6 : 2-アミノ-2-[2-(2-デシル-5-ピリジル)エチル]
-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 4 7 : 2-アミノ-2-[13-(3-ピリジル)トリデシル]-1,
3-プロパンジオール
- 実施例 3 4 8 : 2-アミノ-2-(4-デシルフェニル)-1, 3-プロパンジ
オール
- 実施例 3 4 9 : 2-アミノ-2-(4-ドデシルフェニル)-1, 3-プロパン
ジオール
- 実施例 3 5 0 : 2-アミノ-2-(4-テトラデシルフェニル)-1, 3-プロ
パンジオール
- 実施例 3 5 1 : 2-アミノ-2-(4-ヘキサデシルフェニル)-1, 3-プロ
パンジオール
- 実施例 3 5 2 : 2-アミノ-2-[1-ヒドロキシ-2-(4-オクチルフェニ
ル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 5 3 : 2-アミノ-2-[2-(4-ドデシルフェニル)-1-ヒドロ
キシエチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 5 4 : 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルオキシフェニル)-1-
ヒドロキシエチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 5 5 : 2-アミノ-2-[1-ヒドロキシ-2-(4-ウンデシルオキ
シフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 5 6 : 2-アミノ-2-[2-(4-(8-フルオロオクチル)フェニ
ル)-1-ヒドロキシエチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 5 7 : 2-アミノ-2-[2-(4-(12-フルオロドデシル)フェ
ニル)-1-ヒドロキシエチル]-1, 3-プロパンジオール
- 実施例 3 5 8 : 2-アミノ-2-[2-(4-(7-フルオロヘプチルオキシ)
フェニル)-1-ヒドロキシエチル]-1, 3-プロパンジオー
ル
- 実施例 3 5 9 : 2-アミノ-2-[1-ヒドロキシ-2-(4-(11-フルオ

ロウンデシルオキシ) フェニル) エチル] - 1, 3-プロパンジオール

実施例 3 6 0 : 2-アミノ-2-[2-(4-オクチルフェニル) エテニル] - 1, 3-プロパンジオール

実施例 3 6 1 : 2-アミノ-2-[2-(4-デシルフェニル) エテニル] - 1, 3-プロパンジオール

実施例 3 6 2 : 2-アミノ-2-[2-(4-ドデシルフェニル) エテニル] - 1, 3-プロパンジオール

実施例 3 6 3 : 2-アミノ-2-[2-(4-テトラデシルフェニル) エテニル] - 1, 3-プロパンジオール

実施例 3 6 4 : 2-アミノ-2-(4-オクチルフェノキシメチル) - 1, 3-プロパンジオール

実施例 3 6 5 : 2-アミノ-2-(4-デシルフェノキシメチル) - 1, 3-プロパンジオール

実施例 3 6 6 : 2-アミノ-2-(4-ドデシルフェノキシメチル) - 1, 3-プロパンジオール

実施例 3 6 7 : 2-アミノ-2-(4-テトラデシルフェノキシメチル) - 1, 3-プロパンジオール

実施例 3 6 8 : 2-アミノ-2-(1-ヒドロキシ-2-フェニルエチル) - 1, 3-プロパンジオール・塩酸塩

融点 = 188 ~ 190 °C

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ (ppm) :

2.57 (1H, dd, $J=10.7, 14.2\text{Hz}$), 2.88 (1H, d, $J=14.2\text{Hz}$), 3.63 (4H, m), 3.85 (1H, d, $J=10.7\text{Hz}$), 5.16 (1H, br.s), 5.28 (2H, br.s), 7.25 (5H, m), 7.77 (3H, br.s)

IR ν (KBr) max : 3156, 2814, 1626, 1550, 1080, 1056, 743, 702 cm^{-1}

実施例 3 6 9 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-(1-アセトキシ-2-フェニルエチル) プロパン、

透明オイル

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm) :

1.89 (3H, s), 1.94 (3H, s), 2.08 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.83 (1H, dd, $J=10.3, 14.2\text{Hz}$), 3.05 (1H, dd, $J=3.4, 14.2\text{Hz}$), 4.46 (1H, d, $J=11.7\text{Hz}$), 4.48 (1H, d, $J=11.7\text{Hz}$), 4.55 (1H, d, $J=11.7\text{Hz}$), 4.71 (1H, d, $J=11.7\text{Hz}$), 5.66 (1H, dd, $J=3, 4, 10.3\text{Hz}$), 5.86 (1H, s, -NH), 7.22 (5H, m)

実施例 370 : (Z) - 2 - アミノ - 2 - スチリル - 1, 3 - プロパンジオール

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm) :

2.62 (4H, br.s), 3.47 (2H, d, $J=11\text{Hz}$), 3.55 (2H, d, $J=11\text{Hz}$), 5.55 (1H, d, $J=12.7\text{Hz}$), 6.74 (1H, d, $J=12.7\text{Hz}$), 7.27 (5H, m)

実施例 371 : (E) - 2 - アミノ - 2 - スチリル - 1, 3 - プロパンジオール

 $^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD) δ (ppm) :

3.51 (2H, d, $J=11\text{Hz}$), 3.63 (2H, d, $J=11\text{Hz}$), 6.10 (1H, d, $J=16.4\text{Hz}$), 6.55 (1H, d, $J=16.4\text{Hz}$), 7.23 (5H, m)

実施例 372 : 2 - アセタミド - 2 - [2 - (4 - デシルフェニル) エチル] - 1, 3 - プロパンジオール ジアセテート

融点 = 101 ~ 104 °C

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm) :

0.88 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.26 ~ 1.29 (16H, m), 1.95 (3H, s), 2.09 (6H, s), 2.17 ~ 2.21 (2H, m), 2.54 ~ 2.60 (4H, m), 4.35 (4H, s), 5.63 (1H, s), 7.09 (4H, s)

IR ν : 3310, 2919, 1735, 1654, 1231, 1058 cm^{-1}

実施例 373 : 2 - アミノ - 2 - [2 - (4 - デシルフェニル) エチル] - 1, 3 - プロパンジオール・塩酸塩

融点 = 111 ~ 115 °C

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm) :

0.88 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.26 ~ 1.29 (16H, s), 1.92 ~ 1.96 (2H, m), 2.56

(2H, t, $J=8\text{Hz}$), 2.61~2.65 (2H, m), 3.71 (4H, q, $J=12\text{Hz}$), 7.11 (4H, s)

IR ν : 3373, 2923, 1603, 1518, 1070 cm^{-1}

実施例 374: 2-アセタミド-2-[2-(4-(4-メチルペンチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール ジアセテート

融点 = 83~87°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm):

0.91 (6H, d, $J=6\text{Hz}$), 1.57 (4H, s), 1.96 (3H, s), 2.09 (6H, s), 2.15~2.19 (2H, m), 2.51~2.58 (2H, m), 3.91 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.34 (4H, s), 6.81 (2H, d, $J=4\text{Hz}$), 7.08 (2H, d, $J=4\text{Hz}$)

IR ν : 3310, 2954, 1735, 1649 cm^{-1}

元素分析値: 計算値: C 65.54, H 8.37, N 3.32

分析値: C 65.60, H 8.40, N 3.43

実施例 375: 2-アミノ-2-[2-(4-(4-メチルペンチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール・1/10水和物

融点 = 125~128°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm):

0.83 (6H, d, $J=6\text{Hz}$), 1.25 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.54~1.58 (3H, m), 1.66~1.72 (2H, m), 2.47~2.51 (2H, m), 3.39~3.50 (4H, m), 3.81~3.85 (2H, m), 6.73 (2H, d, $J=12\text{Hz}$), 7.02 (2H, d, $J=12\text{Hz}$)

IR ν : 3324, 2951, 1513, 1247, 1026 cm^{-1}

実施例 376: 2-アセトアミド-2-(2-ピリジルメチル)-1, 3-プロパンジオール

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm):

1.66 (2H, br.s, OH), 1.94 (3H, s, CH_3), 3.26 (2H, s, CH_2), 3.56 (4H, dd, $J=72, 12\text{Hz}$, $\text{CH}_2 \times 2$), 6.97 (1H, br.s, NH), 7.23 (1H, dd, $J=8.0, 4.0\text{Hz}$, ArH), 7.33 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$, ArH), 7.69 (1H, dt, $J=8.0, 4.0\text{Hz}$, ArH), 8.49 (1H, d, $J=4.0\text{Hz}$, ArH)

実施例 377 : 2-アセトアミド-2-(2-ピリジルメチル)-1,3-ジアセトキシプロパン

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) :

1.96 (3H, s, CH_3), 2.05 (6H, s, $\text{CH}_3 \times 2$), 3.13 (2H, s, CH_2), 4.47 (4H, dd, $J=40, 12\text{Hz}$, $\text{CH}_2 \times 2$), 7.15 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$, ArH), 7.21 (1H, dd, $J=8.0, 4.0\text{Hz}$, ArH), 7.48 (1H, s, NH), 7.65 (1H, dt, $J=8.0, 4.0\text{Hz}$, ArH), 8.55 (1H, d, $J=4.0\text{Hz}$, ArH)

IR ν (KBr) max : 3320(NH), 1748 (CO), 1654, 1533, 1248 cm^{-1}

MS : 308 ($\text{M}^+ + 1$)

融点 = 109 ~ 110 $^{\circ}\text{C}$

実施例 378 : 2-アミノ-2-(2-ピリジルメチル)-1,3-プロパンジオール・3/4水和物・2塩酸塩

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CD_3OD) δ (ppm) :

3.53 (2H, s, ArCH_2), 3.65 (4H, ddd, $J=24, 12, 4.0\text{Hz}$, $\text{CH}_2 \times 2$), 4.88 (6H, br.s, $\text{OH} \times 2$, N^+H_2 , N^+), 8.02 (1H, t, $J=8.0\text{Hz}$, ArH), 8.09 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$, ArH), 8.57 ~ 8.61 (1H, m, ArH), 8.81 (1H, d, $J=4.0\text{Hz}$, ArH)

IR ν (KBr) max : 3385, 3070, 3059, 2945, 2897, 1621, 1066 cm^{-1}

MS : 183 (M^+)

融点 = 165 ~ 170 $^{\circ}\text{C}$

実施例 379 : 2-アセトアミド-2-[2-(5-ブチルピリジル)メチル]-1,3-プロパンジオール

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) :

0.94 (3H, t, $d=8.0\text{Hz}$, CH_3), 1.26 (2H, t, $J=8.0\text{Hz}$, CH_2), 1.36 (2H, m, CH_2), 1.59 (2H, br.s, $\text{OH} \times 2$), 1.93 (3H, s, CH_3), 2.58 ~ 2.62 (2H, m, CH_2), 3.21 (2H, s, CH_2), 3.55 (4H, dd, $J=72, 12\text{Hz}$, $\text{CH}_2 \times 2$), 6.97 (1H, br.s, NH), 7.22 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$, ArH), 8.45 ~ 8.50 (1H, m, ArH), 8.31 (1H, br.s, ArH)

IR ν (neat) max : 3378(OH), 2958, 2933, 2862, 1738(CO), 1658 cm^{-1}
 オイル

実施例 380 : 2-アセトアミド-2-[2-(5-ブチルピリジル)メチル]
 -1, 3-ジアセトキシプロパン

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) :

0.94 (3H, t, $J=8.0\text{Hz}$, CH_3), 1.33~1.42 (2H, m, CH_2), 1.56~1.64 (2H, m, CH_2), 1.96 (3H, s, CH_3), 2.05 (6H, s, $\text{CH}_3 \times 2$), 2.60 (2H, t, $J=8.0\text{Hz}$, CH_2), 3.08 (2H, s, CH_2), 4.46 (4H, dd, $J=40, 12\text{Hz}$, $\text{CH}_2 \times 2$), 7.05 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$, ArH), 7.44~7.46 (1H, m, ArH), 7.56 (1H, s, NH), 8.35~8.37 (1H, m, ArH)

IR ν (KBr) max : 3371, 3290, 2959, 2934, 1745(CO), 1681, 1240 cm^{-1}
 オイル

実施例 381 : 2-アミノ-2-[2-(5-ブチルピリジル)メチル] 1, 3-
 -プロパンジオール

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) :

0.94 (3H, t, $J=8.0\text{Hz}$, CH_3), 1.36 (2H, dt, $J=16, 8.0\text{Hz}$, CH_2), 1.59 (2H, dt, $J=16, 8.0\text{Hz}$, CH_2), 2.60 (2H, t, $J=8.0\text{Hz}$, CH_2), 2.92 (2H, s, CH_2), 1.20~3.00 (4H, m, OH $\times 2$, NH $_2$), 3.39 (4H, dd, $J=36, 12\text{Hz}$, $\text{CH}_2 \times 2$), 7.13 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$, ArH), 7.48 (1H, dd, $J=8.0, 2.0\text{Hz}$, ArH), 8.33 (1H, d, $J=2.0\text{Hz}$, ArH)

IR ν (KBr) max : 3339, 3269, 2923, 2857, 1595, 1033 cm^{-1}

融点 = 63~65 $^{\circ}\text{C}$

実施例 382 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-[2-(1-オ
 クチルピペリジン-4-イル)エチル]プロパン

融点 = 93~95 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm) :

0.85 (3H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 1.19~1.36 (15H, m), 1.50 (2H, br.s), 1.64 (2H, d, $J=11.8\text{Hz}$), 1.85~1.97 (3H, m), 1.93 (3H, s), 2.05 (6H, s),

2.33 (2H, br.s), 2.97 (2H, br.s), 4.25 (4H, s), 5.61 (1H, s)

IR ν (KBr) max : 3302, 1739, 1654, 1560 cm^{-1}

実施例 383 : 2-アセトアミド-2-(2-プロペニル)-1, 3-プロパンジオール

淡黄色液体

Rf 値 : 0.55 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 - CD_3OD) δ (ppm) :

1.95 (3H, s), 2.33 (2H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 3.49 (2H, d, $J=11.7\text{Hz}$), 3.64 (2H, d, $J=11.7\text{Hz}$), 5.07 ~ 5.10 (2H, m), 5.66 ~ 5.90 (1H, m)

IR ν (neat) : 3310, 1641 cm^{-1}

MS (EI) : 174 ($M+1$)

実施例 384 : 2-アミノ-2-(2-プロペニル)-1, 3-プロパンジオール・8/5水和物・塩酸塩

褐色液体

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm) :

2.33 (2H, d, $J=10.7\text{Hz}$), 3.56 (4H, dd, $J=3.0\text{Hz}$, $J=19.0\text{Hz}$), 3.39 (1H, br.s), 5.14 ~ 5.22 (2H, m), 5.62 ~ 5.23 (1H, m)

IR ν (neat) : 3445, 1614, 1516 cm^{-1}

MS (EI) : 132 ($M+1$)

元素分析値 : 計算値 : C 36.68, H 8.82, N 7.13

分析値 : C 36.27, H 8.47, N 7.26

実施例 385 : 2-アミノ-2-フェニルメチルオキシメチル-1, 3-プロパンジオール・1/10水和物・塩酸塩

融点 = 113 ~ 114 $^{\circ}\text{C}$

実施例 386 : 2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-フェニルメチルオキシメチルプロパン

IR ν (neat) : 3307, 2934, 1743, 1662, 1549 cm^{-1}

実施例 387 : 2-アミノ-2-[2-(4-ノニルフェニル)エチル]-1,

3-プロパンジオール・1/3水和物・塩酸塩

融点=95~97℃

元素分析値：計算値：C 66.00, H 10.15, N 3.85

分析値：C 66.19, H 10.24, N 3.86

実施例387：2-アセトアミド-1, 3-ジアセトキシ-2-〔2-(4-ノニルフェニル)エチル〕プロパン

融点=95~98℃

実施例388：2-アセトアミド-2-〔2-(4-ウンデシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール

融点=90~91℃

実施例389：2-アミノ-2-〔2-(4-ウンデシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール

融点=105~107℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ (ppm) :

0.88 (3H, t, J=6.8Hz), 1.20 ~ 1.80 (24H, m), 2.56 (2H, t, J=7.8Hz),
2.61 (2H, m), 3.51 (2H, d, J=10.8Hz), 3.61 (2H, d, J=10.8Hz), 7.10
(4H, s)

実施例390：2-アセトアミド-4-(4-ヘプチルフェニル)-2-ヒドロキシメチル-1, 4-ブタンジオール

融点=117~118℃

実施例391：2-アセトアミド-4-(4-オクチルフェニル)-2-ヒドロキシメチル-1, 4-ブタンジオール

融点=118~119℃

実施例392：2-アセトアミド-2-〔2-(4-ヘプチルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール

融点=89~90℃

実施例393：2-アセトアミド-2-1, 3-プロパンジイル-〔2-(4-ヘプチルフェニル)エチル〕イリデン ジアセテート

融点 = 108 ~ 109 °C

実施例 394 : 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩

融点 = 134 ~ 135 °C

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO only) δ (ppm) :

0.83 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.17 ~ 2.33 (8H, m), 1.45 ~ 1.58 (2H, m), 1.69 ~ 1.79 (2H, m), 2.48 ~ 2.62 (4H, m), 3.34 (2H, br.s), 3.48 (4H, s), 7.08 (4H, s), 7.47 (3H, br.s)

$\text{IR } \nu$ (KBr) max : 3369, 2926, 1515, 1467, 1059 cm^{-1}

実施例 395 : 2-アセトアミド-1, 3-プロパンジイル-2-[2-(4-テトラデシルフェニル)エチル]イリデン ジアセテート

融点 = 125 ~ 126 °C

実施例 396 : 2-アミノ-2-[2-(4-テトラデシルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール・塩酸塩

融点 = 123 ~ 124 °C

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- CDCl_3) δ (ppm) :

0.80 (3H, t, $J=6\text{Hz}$), 1.02 ~ 1.24 (22H, m), 1.45 ~ 1.53 (2H, m), 1.88 (2H, m, $J=4\text{Hz}$), 2.46 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 2.56 ~ 2.62 (2H, m), 3.56 (2H, dd, $J=12\text{Hz}$, 31Hz), 3.57 (2H, dd, $J=12\text{Hz}$, 31Hz), 4.90 (2H, br.s), 7.01 (4H, dd, $J=7\text{Hz}$, 12Hz), 7.99 (3H, br.s)

$\text{IR } \nu$ (KBr) max : 3374, 3268, 2922, 1516, 1469, 1069 cm^{-1}

実施例 397 : N-メチルアミノ-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm) :

0.80 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.09 ~ 1.39 (10H, m), 1.45 ~ 1.56 (2H, m), 1.56 ~ 1.76 (2H, m), 2.41 (3H, s), 2.44 ~ 2.61 (4H, m), 3.32 (3H, br.s), 3.47 ~ 3.81 (4H, m), 7.01 (4H, s)

$\text{IR } \nu$ (neat) : 3386, 2927, 1467, 1058, 909 cm^{-1}

実施例 398 : 2-アミノ-4-(4-ヘプチルフェニル)-2-ヒドロキシメチル-1, 4-ブタンジオール塩酸塩

融点 = 105 ~ 108 °C

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO) δ (ppm) :

0.86 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.17 ~ 1.36 (8H, m), 1.46 ~ 1.63 (2H, m), 1.76 (2H, dd, $J=7\text{Hz}$, 18Hz), 2.54 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.34 (3H, br.s), 3.58 (4H, dd, $J=11\text{Hz}$, 35Hz), 4.83 ~ 4.92 (1H, m), 6.99 (3H, br.s), 7.18 (4H, dd, $J=7\text{Hz}$, 37Hz)

IR ν (KBr) max : 3388, 2928, 1610, 1511, 1063 cm^{-1}

実施例 399 : 2-アミノ-4-(4-オクチルフェニル)-2-ヒドロキシメチル-1, 4-ブタンジオール・1/4水和物

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ (ppm) :

0.86 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.22 ~ 1.38 (10H, m), 1.54 ~ 1.68 (3H, m), 1.68 ~ 1.79 (1H, m), 2.59 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.40 (3H, br.s), 3.50 (4H, dd, $J=8\text{Hz}$, 38Hz), 3.63 (2H, br.s), 4.91 (1H, m), 7.20 (4H, dd, $J=6\text{Hz}$, 30Hz)

IR ν (neat) : 3340, 3286, 2925, 1465, 1027 cm^{-1}

以下に実験例を挙げて、本発明の作用・効果をさらに詳細に説明する。

免疫抑制活性測定法としては、マウス、ラットあるいはヒトのリンパ球を用いた種々の免疫反応を用いることができるが、例えば免疫抑制活性は、マウス、ラット、ヒトの同種リンパ球混合反応（同種MLR）を用いることにより感度よく測定できる。

同種MLRとは、同種でしかも主要組織適合性抗原が異なる2個体由来のリンパ球、例えば脾細胞、リンパ節細胞、末梢血リンパ球等を混合培養することによって誘導されるリンパ球の幼若化反応である。また、同種MLRは、リンパ球の供与者間の主要組織適合性抗原の違いを反映し誘導される現象であり、例えば一卵性双生児のリンパ球の混合培養によるリンパ球の幼若化現象は認められない。そこで同種MLRは、例えば臓器移植における供与者-受容者の選択に広く用い

られている方法である。

通常、同種MLRを行う場合には、一方のリンパ球をX線照射あるいはマイトマイシンC処理等を行うことによって、分裂増殖を阻止した状態で刺激細胞として用い、他方のリンパ球（反応細胞）の幼若化反応を測定する方法（one way-MLR）を用いることができる。

さらに免疫抑制活性は、同種MLRの際に誘導される主要組織適合性抗原拘束性を有する細胞障害性T細胞の誘導を抑制する活性としても測定することができる。

また、免疫抑制活性は、同種MLRの他に、種々のマイトージェン（コンカナバリンA、フィトヘムアグルチニン、ポークウィードマイトージェン等）の刺激により誘導されるリンパ球の幼若化反応を抑制する活性、またはT細胞、B細胞等のリンパ球の分裂増殖を増強もしくは分化を促進する活性を有するようなサイトカイン（インターロイキン1、2、3、4、5、6等）により誘導されるリンパ球の分裂増殖反応、または機能の発現を抑制する活性としても評価することができる。さらに、これらサイトカインのT細胞、マクロファージ等からの産生を抑制する活性としても評価することが可能である。

さらに、化合物をマウス等に腹腔内、経口、静脈内、皮内、皮下または筋肉内投与をすることによって、例えば同種細胞等で予め免疫されたマウスの脾細胞中に誘導される同種細胞特異的細胞障害性T細胞の誘導を抑制する活性、ならびに同種細胞等で免疫したマウスの血清中に産生される同種細胞特異抗体の産生を抑制する活性、または同種マウスのラット、イヌなどの臓器移植の際の拒絶反応、あるいは移植片対宿主反応、あるいは遅延型アレルギー、アジュバント関節炎等を抑制する活性としても評価することができる。

また、自己免疫疾患のモデル動物であるMRL/lprマウス、NZB/WF₁マウス、BXSBマウス、NODマウス等に化合物を投与することによる、例えば抗DNA抗体の産生、リウマチ因子の産生、腎炎、リンパ球の増殖異常、尿タンパク等の抑制活性あるいは延命効果としても評価することができる。

実験例1（マウス同種リンパ球混合反応に対する抑制作用）

マウス同種リンパ球混合反応（以下、マウス同種MLRと称する）は、反応細胞としてBALB/cマウスの脾細胞を、刺激細胞としてC57BL/6マウスの脾細胞をマイトマイシンC処理したものを用い、両者を等比で混合培養することによって行う。

反応細胞の調製法としては、以下の方法で行う。5～6週齢のBALB/cマウスより脾臓を摘出し、熱不活化牛胎児血清（以下、FCSと称する）を5%添加したRPMI 1640培地（硫酸カナマイシン $60\mu\text{g}/\text{ml}$ 、ペニシリンGカリウム $100\text{単位}/\text{ml}$ 、N-2-ヒドロキシエチルピペラジン-N'-2-エタンスルホネート 10mM 、 0.1% 炭酸水素ナトリウム、L-グルタミン 2mM 含有）を用いて、脾細胞の単細胞浮遊液を得る。溶血処理後、 10^{-4}M 2-メルカプトエタノールおよび 10% FCSを含むRPMI 1640培地を用いて、 10^7 個/ ml に調製し、反応細胞浮遊液として用いる。

刺激細胞は以下の方法で調製する。5～6週齢のC57BL/6マウスより脾臓を摘出し、RPMI 1640培地を用いて脾細胞の単細胞浮遊液を得る。溶血処理後、 $40\mu\text{g}/\text{ml}$ マイトマイシンCで 37°C 、60分間の処理を行う。3回洗浄後、 10^{-4}M 2-メルカプトエタノールおよび 10% FCSを含むRPMI 1640培地を用いて、 10^7 個/ ml に調製し、刺激細胞浮遊液として用いる。

上述した方法により調製した反応細胞浮遊液 $50\mu\text{l}$ と刺激細胞浮遊液 $50\mu\text{l}$ および 10% FCSを含むRPMI 1640培地を用いて調製した被検体 $100\mu\text{l}$ とを、96穴平底マイクロテストプレートに加え、 37°C で 5% 炭酸ガス 95% 空気の条件下で4日間培養を行う。

マウス同種MLRにおけるリンパ球の幼若化反応の測定法としては、 ^3H -チミジンの取り込みを指標とする方法を用いる。即ち、培養終了後に ^3H -チミジン $18.5\text{KBq}/\text{ウェル}$ を添加し、4時間培養後、セルハーベスターにて細胞を収集し、細胞内に取り込まれた放射活性を液体シンチレーションカウンターにて測定し、マウス同種MLRのリンパ球幼若化の指標とする。マウス同種MLRの抑制活性は、数1の式により抑制率を算出し評価する。

本発明の化合物のうち、好ましい化合物群はマウス同種リンパ球混合反応に対して、約1～約50 nMのIC₅₀値（50%抑制する濃度）を示す。

本発明の化合物のうち、好ましい化合物群はマウス同種リンパ球混合反応に対して、約1～約50 nMのIC₅₀値（50%抑制する濃度）を示す。

$$\text{抑制率} = \left[1 - \frac{\left\{ \begin{array}{c} \text{被検体を添加した} \\ \text{MLRのcpm} \end{array} \right\} - \left\{ \begin{array}{c} \text{反応細胞のみ} \\ \text{のcpm} \end{array} \right\}}{\left\{ \begin{array}{c} \text{被検体未添加の} \\ \text{MLRのcpm} \end{array} \right\} - \left\{ \begin{array}{c} \text{反応細胞のみ} \\ \text{のcpm} \end{array} \right\}} \right] \times 100$$

(%)

実験例2（インターロイキン2（IL-2）により誘導されるIL-2依存性マウスT細胞株CTL-2の増殖に対する抑制作用）

IL-2依存性マウスT細胞株CTL-2を10%FCSを含むRPMI 1640培地にて 2×10^5 個/mlに調製する。この細胞浮遊液50 μ lと、リコンビナントヒトIL-2（rh-IL-2）40U/mlを50 μ l、および10%FCSを含むRPMI 1640培地を用いて調製した被検体100 μ lとを96穴平底マイクロテストプレートに加え、37℃、5%炭酸ガス95%空気の条件下で68時間培養を行う。培養終了後、各ウエルの上清100 μ lを除去し、5mg/mlのMTT（3-（4，5-ジメチルチアゾール-2-イル）-2，5-ジフェニルテトラゾリウムブロマイド）溶液を20 μ lずつ各ウエルに添加し、4時間、37℃でインキュベートする。その後、10%ドデシル硫酸ナトリウムを含む0.01N塩酸溶液100 μ lを加え、一晩37℃でインキュベートし、形成された紫色のホルマザンの結晶を溶解させ、マイクロプレート吸光度計を用いて570nmにおける吸光度を測定し、IL-2依存性のCTL-2細胞の増殖の指標とする。IL-2依存性増殖の抑制率（%）は数2の式により算出する。

本発明の化合物のうち、好ましい化合物群は、マウスT細胞株CTL-2の

I-L-2 依存性増殖に対して、約1～約50 nMのIC₅₀値（50%抑制する濃度）を示す。

$$\text{抑制率} = \left[1 - \frac{\left[\begin{array}{c} \text{被検体及びrh-IL-2 を} \\ \text{添加した場合の吸光度} \end{array} \right] - \left[\begin{array}{c} \text{rh-IL-2 未添加} \\ \text{の場合の吸光度} \end{array} \right]}{\left[\begin{array}{c} \text{rh-IL-2 のみを添加} \\ \text{した場合の吸光度} \end{array} \right] - \left[\begin{array}{c} \text{rh-IL-2 未添加} \\ \text{の場合の吸光度} \end{array} \right]} \right] \times 100$$

(%)

実験例3（ラット同種皮膚移植における生着延長効果）

4週齢の雄性WKAHラットまたはLEWラットの全層皮膚移植片（1.5×1.5 cm）を4週齢の雄性F344ラットの背部移植床に縫合により移植を行い、無菌のガーゼでおおい包帯する。包帯は移植後5日目に除去し、移植片が拒絶されるまで毎日観察を行う。皮膚移植片の拒絶は移植片の上皮の90%以上が壊死を起し褐色になった時点で判定する。移植した日から拒絶された時点までの日数を移植片の生着日数とする。試験化合物は移植当日から1日1回、9日目まで10回腹腔内、静脈内あるいは経口投与を行う。

試験化合物未投与のときには、WKAHラットの皮膚をF344ラットに移植した場合の平均生着日数は6.6±0.5日、またはLEWラットの皮膚をF344ラットに移植した場合の平均生着日数は8.2±0.4であった。

本発明のなかで望ましい化合物は0.1～10 mg/kgの投与によりWKAHラットの皮膚をF344ラットに移植した場合には平均生着日数は10日以上、またLEWラットの皮膚をF344ラットに移植した場合には平均生着日数は20日以上で、試験化合物未投与群に対して統計学的に有意な生着延長効果を示す。

実験例4（ラットアジュバント関節炎に対する抑制作用）

アジュバントとして結核死菌（R35H5v-1株）0.5 mgを1.0 mlの流動パラフィンに懸濁し、10週齢の雄性LEWラットの尾根部に接種しアジュバント関節炎を発症させる。アジュバント接種後、毎日観察を行い関節炎の発

症日、発症率、体重変化を測定するとともに、21日目に後肢足の腫張および臓器重量を測定する。試験化合物はアジュバント接種当日から1日1回、21日目まで22回静脈内あるいは経口投与を行う。

試験化合物未投与のときには、アジュバント接種ラットにおいて関節炎は9.6 ± 0.5日で7例中全例が発症し、後肢足の腫張および骨破壊が認められた。またアジュバント関節炎の発症に伴い、体重の減少、腎および副腎重量の増加、胸腺重量の減少が認められた。

本発明のなかで望ましい化合物は0.1～10mg/kgの投与によりアジュバント関節炎の発症日を統計学的に有意に遅延させ、発症率を減少させるとともに、後肢足の腫張および骨破壊を有意に抑制する。また、アジュバント関節炎の発症に伴う体重の減少、腎および副腎重量の増加、胸腺重量の減少の有意な改善作用が認められる。

上記した薬理実験を含む各種実験から明らかなように、本発明の化合物またはそれらの塩は優れた免疫抑制作用を有し、医薬として有用である。

処方例

(1)ソフトカプセル剤（1カプセル中）

本発明の化合物	30mg
ポリエチレングリコール-300	300mg
ポリソルベート80	20mg

計	350mg
---	-------

製造方法

本発明の化合物にポリエチレングリコール-300およびポリソルベート80を加え、ソフトカプセルに充填して製する。

(2)注射剤（1アンプル 10ml中）

本発明の化合物	0.3%
ポリエチレングリコール-300	20%
エタノール	60%

注射用蒸留水で全量 10 ml とする。

製造方法

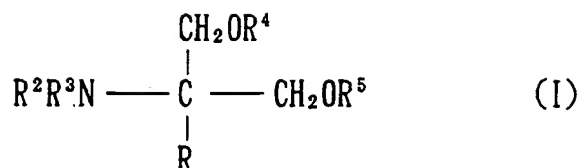
本発明の化合物にエタノールおよびポリエチレングリコール-300を加えて溶解し、注射用蒸留水を加えて全容とする。

1 アンプル 10 ml 中本発明の化合物 30 ml を含有した注射剤を得る。

本発明を実施例を含む明細書により具体的に説明したが、特に実施例は本発明の精神と範囲に反しない限り、種々に変更、修飾することができる。

請求の範囲

1. 一般式



〔式中、Rは置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖〔当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-\text{N}(\text{R}^6)-$ （ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す）、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体が置換していてもよい〕または置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、 R^4 、 R^5 がアルキル、アリアルまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。〕

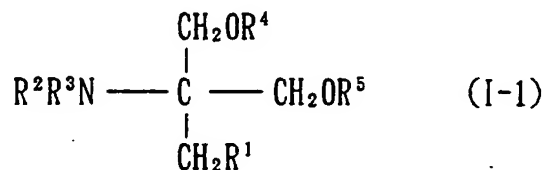
ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体から

選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。さらに、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、Rが炭素数1～5個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、Rがフリルメチル、フェニルメチルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルメチルのとき、R²、R³の一方はメチルまたはエチルではない。〕により表される2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

2. 一般式



〔式中、R¹は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖（当該鎖

中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-N(R^6)$ (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端 (ω 位) に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体が置換していてもよい} または置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、 R^4 、 R^5 がアルキル、アリアルまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

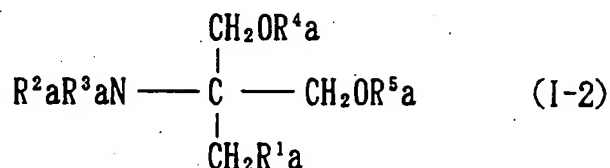
ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニ

ルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、 R^1 が炭素数 1～4 個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1 がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルのとき、 R^2 、 R^3 の一方はメチルまたはエチルではない。) により表される請求の範囲 1 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

3. 一般式



〔式中、 $R^1\text{a}$ は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 (当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-\text{N}(\text{R}^6)-$ (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンから選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい)、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいシクロアルキルを示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルは、置換基として、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖 (当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-\text{N}(\text{R}^6)-$ (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルま

たはアルコキシカルボニルを示す)、カルボニル、置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンから選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい)、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいフェノキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルから選ばれる基を有していてもよい。

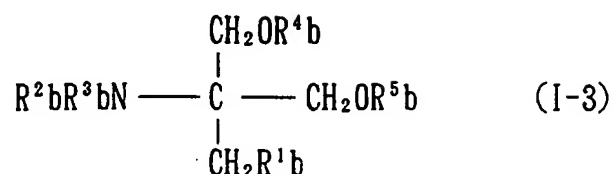
また、置換基を有していてもよい炭素鎖は、置換基として、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいフェノキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルから選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいフェニレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいフェノキシおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルは、その置換基として、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。

ただし、 R^1a が炭素数1～4個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1a がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニルのとき、 R^2a 、 R^3a の一方はメチルまたはエチルではない。)により表される

請求の範囲 1 または 2 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

4. 一般式



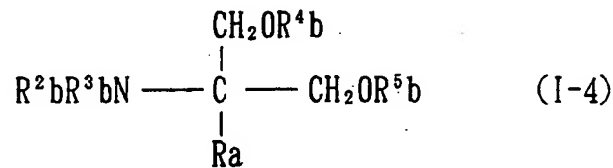
〔式中、 R^1b は置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいフェニルまたは置換基を有していてもよいシクロアルキルを示し、 R^2b 、 R^3b 、 R^4b 、 R^5b は同一または異なってそれぞれ水素、アルキルまたはアシルを示す。〕

ここで、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニルは、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルから選ばれる基を有していてもよい。また、前記置換基を有していてもよいフェニルおよび置換基を有していてもよいシクロアルキルは、置換基として、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシおよびカルボキシから選ばれる 1～3 個を有することができる。

ただし、 R^1b が炭素数 1～4 個のアルキルのとき、当該アルキルは置換されていなければならない。また、 R^1b がフリル、フェニルであるか、または低級アルキル、低級アルコキシ、クロロ、ヒドロキシもしくはアミノで置換されたフェニ

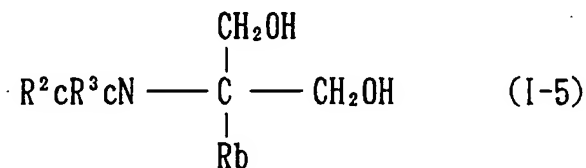
ルのとき、 R^2b 、 R^3b の一方はメチルまたはエチルではない。) により表される請求の範囲 3 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

5. 一般式



〔式中、 R^a は鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-N(R^6)-$ (ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す) およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい炭素数 12 から 22 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示し、 R^2b 、 R^3b 、 R^4b 、 R^5b は同一または異なってそれぞれ水素、アルキルまたはアシルを示す。) により表される請求の範囲 1、2、3 または 4 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

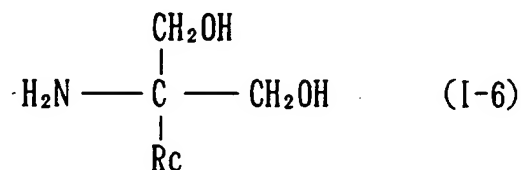
6. 一般式



〔式中、 R^b は鎖中に酸素原子を有していてもよく、また置換基として、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい炭素数 13 から 20 個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示し、 R^2c 、 R^3c は同一または異なっ

てそれぞれ水素、アルキルを示す。)により表される請求の範囲5記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

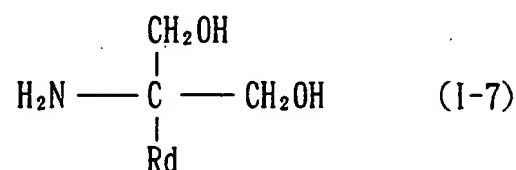
7. 一般式



〔式中、Rcは炭素数13から20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルまたは置換基としてハロゲンを有する炭素数13から20個の直鎖または分枝鎖状のアルキルを示す。〕により表される請求の範囲5または6記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

8. 2-アミノ-2-トリデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-テトラデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-ペンタデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-ヘキサデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-ヘプタデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-オクタデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-ノナデシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-イコシル-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(12-フルオロドデシル)-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-(14-フルオロテトラデシル)-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲5、6または7記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

9. 一般式



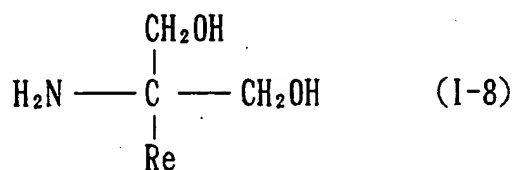
〔式中、Rdはフェニルアルキル、置換フェニルアルキル、シクロアルキルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリ

ールアルキル、ヘテロサイクリックアルキルまたは置換ヘテロサイクリックアルキルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-N(R^6)-$ （ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す）およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。

また、置換フェニルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、置換ヘテロアリールアルキルまたは置換ヘテロサイクリックアルキルは、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、ハロアラルキルオキシ、アラルキルオキシアルキル、フェノキシアルキル、フェノキシアルコキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。〕により表される請求の範囲 1、2、3 または 4 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

10. 一般式

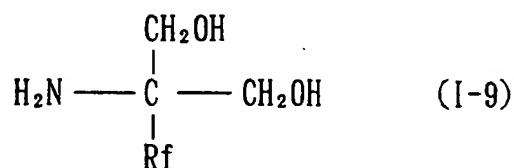


〔式中、Re はアルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいフェニルアルキル；炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状

のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアルキル、フェノキシアルコキシもしくはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキル；アルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいシクロアルキルアルキル；炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたシクロアルキルアルキル；アルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいヘテロアリールアルキル；炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロアリールアルキル；アルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよいヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアルキルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-N(R^6)-$ （ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコシカルボニルを示す）およびカルボニルから選ばれる結合または複素原子を有していてもよく、また置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコシカルボニル、アルコシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。）により表される請求の範囲 9 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

11. 一般式

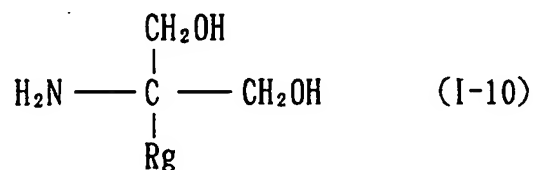


〔式中、Rf はアルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が 1 または 2 個介在していてもよいフェ

ニルアルキル；炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアルキル、フェノキシアルコキシもしくはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキル；アルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が 1 または 2 個介在していてもよいシクロアルキルアルキル；炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたシクロアルキルアルキル；アルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が 1 または 2 個介在していてもよいヘテロアリールアルキル；炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロアリールアルキル；アルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が 1 または 2 個介在していてもよいヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数 6～20 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアルキルを示す。

ここで、アルキル部は炭素鎖に置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシを有していてもよい。) により表される請求の範囲 9 または 10 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

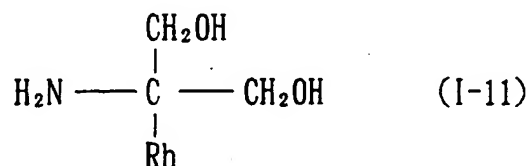
12. 一般式



〔式中、Rg はアルキル部の炭素数が 6～20 個であって、直鎖または分枝鎖状

でもよく、また当該炭素鎖中に酸素原子が1または2個介在していてもよいフェニルアルキル；炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルキル、炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のハロゲンで置換されていてもよいアルコキシ、炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシ、フェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアルキル、フェノキシアルコキシまたはフェノキシアルキルにより置換されたフェニルアルキル；アルキル部の炭素数が6～20個であるシクロアルキルアルキル；炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたシクロアルキルアルキル；アルキル部の炭素数が6～20個であるヘテロアリアルキル；炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロアリアルキル；アルキル部の炭素数が6～20個であるヘテロサイクリックアルキルまたは炭素数6～14個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキルにより置換されたヘテロサイクリックアルキルを示す。)により表される請求の範囲9、10または11記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

13. 一般式



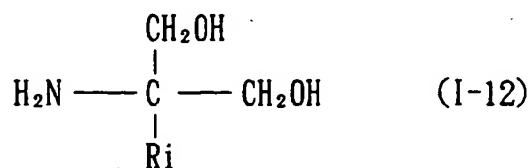
〔式中、Rh はアルキル部の炭素数が6～20個であるフェニルアルキル、アルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が6～20個であるフェニルアルコキシアルキル、アルキル部の炭素数が6～20個であるフェノキシアルキルまたはアルキル部およびアルコキシ部の炭素数の総計が6～20個であるフェノキシアルコキシアルキルを示す。〕により表される請求の範囲12記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

14. 2-アミノ-2-(8-フェニルオクチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(9-フェニルノニル)-1, 3-プロパンジオール、2

-アミノ-2-(10-フェニルデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-ア
 ミノ-2-(11-フェニルウンデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-ア
 ミノ-2-(12-フェニルドデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミ
 ノ-2-(13-フェニルトリデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミ
 ノ-2-(14-フェニルテトラデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-ア
 ミノ-2-(15-フェニルペンタデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-
 アミノ-2-(16-フェニルヘキサデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-
 アミノ-2-[6-(8-フェニルオクチルオキシ)ヘキシル]-1, 3-プ
 ロパンジオール、2-アミノ-2-(8-フェニルメチルオキシオクチル)-1,
 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(9-フェノキシノニル)-1, 3-
 プロパンジオール、2-アミノ-2-(12-フェノキシドデシル)-1, 3-
 プロパンジオールおよび2-アミノ-2-[6-(2-フェノキシエチルオキシ)
 ヘキシル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲13記載の2-
 アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

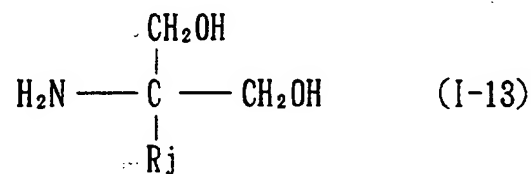
15. 2-アミノ-2-(10-フェニルデシル)-1, 3-プロパンジオール、
 2-アミノ-2-(13-フェニルトリデシル)-1, 3-プロパンジオール、
 2-アミノ-2-[6-(8-フェニルオクチルオキシ)ヘキシル]-1,
 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(8-フェニルメチルオキシオクチル)-
 1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(9-フェノキシノニル)-1,
 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(12-フェノキシドデシル)-1,
 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-[6-(2-フェノキシエチルオ
 キシ)ヘキシル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲13記載
 の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

16. 一般式



〔式中、R_i はハロゲンで置換されていてもよい炭素数 6～14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数 6～14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数 6～14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換されたフェニルアルキルを示す。ここで、フェニルアルキルのアルキル部はヒドロキシで置換されていてもよい。〕により表される請求の範囲 12 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

17. 一般式



〔式中、R_j はハロゲンで置換されていてもよい炭素数 6～14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数 6～14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数 6～14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換され、かつアルキル部が炭素数 2～6 のアルキルであって、当該アルキル部がヒドロキシで置換されていてもよいフェニルアルキルを示す。〕により表される請求の範囲 16 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

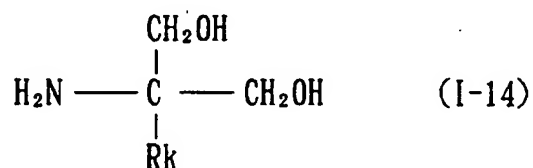
18. 2-アミノ-2-〔2-(4-ヘプチルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-オクチルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ノニルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-デシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ウンデシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ドデシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-トリデシルフェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-テトラデシルフェニル)エチル〕-1, 3-

ープロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ヘキシロキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチロキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-オクチロキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ノニロキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-デシロキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ウンデシロキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ドデシロキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-トリデシロキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(8-フルオロオクチル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(12-フルオロドデシル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(7-フルオロヘプチロキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(11-フルオロウンデシロキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-[2-(4-(7-オクテニロキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲16または17記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

19. 2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ノニルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-デシルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ウンデシルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ドデシルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ヘプチロキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-オクチロキシフェニル)エチル]-

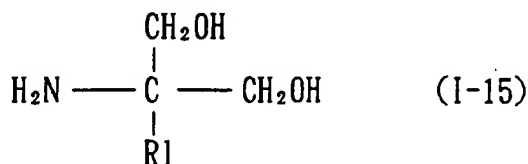
1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ノニルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-[2-(4-(7-オクテニルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲16または17記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

20. 一般式



〔式中、Rk はフェニルアルコキシ、ハロフェニルアルコキシ、フェニルアルコキシアシル、フェノキシアシルまたはフェノキシアシルにより置換されたフェニルアルキルを示す。〕により表される請求の範囲12記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

21. 一般式

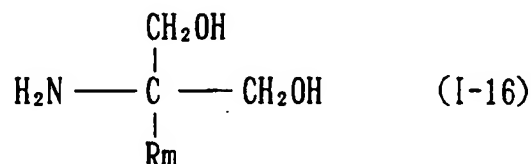


〔式中、R1 はアルコキシ部の炭素数が2～8個であるフェニルアルコキシ、アルコキシ部の炭素数が2～8個であるハロフェニルアルコキシ、アルコキシ部およびアルキル部の総炭素数が2～8個であるフェニルアルコキシアシル、アルコキシ部の炭素数が2～8個であるフェノキシアシルまたはアルキル部の炭素数が2～8個であるフェノキシアシルにより置換されたアルキル部の炭素数が2～6個であるフェニルアルキルを示す。〕により表される請求の範囲20記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

22. 2-アミノ-2-[2-(4-フェニルメチルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(2-フェニルエチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(3-フェニルプロピルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(4-フェニルブチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(5-フェニルペンチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(7-フェニルヘプチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(8-フェニルオクタチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[4-(6-(4-フルオロフェニル)ヘキシルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(5-フェニルペンチルオキシメチル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(4-フェノキシブチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(5-フェノキシペンチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(6-フェノキシヘキシルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(7-フェノキシヘプチルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(4-フェノキシブチル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(5-フェノキシペンチル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-[2-(4-(6-フェノキシヘキシル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-[2-(4-(7-フェノキシヘプチル)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲20または21記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

23. 2-アミノ-2-〔2-(4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔2-(4-(5-フェニルペンチルオキシメチル)フェニル)エチル〕-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲20または21記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

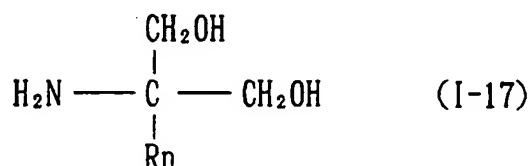
24. 一般式



〔式中、R_m はアルキル部の炭素数の総計が6～20個であるアルキル置換シクロアルキルアルキルを示す。〕により表される請求の範囲12記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

25. 2-アミノ-2-〔3-(4-ヘプチルシクロヘキシル)プロピル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔4-(4-ブチルシクロヘキシル)ブチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-オクチルシクロヘキシル)エチル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ノニルシクロヘキシル)エチル〕-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔2-(4-ドデシルシクロヘキシル)エチル〕-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲24記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

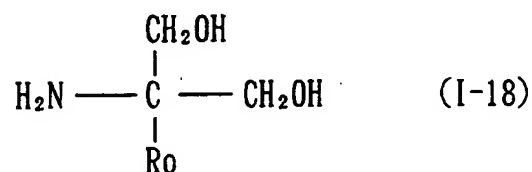
26. 一般式



(式中、R_n はアルキル部の炭素数の総計が6～20個である1-アルキル置換ピペリジン-4-イルアルキルを示す。) により表される請求の範囲12記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

27. 2-アミノ-2-〔2-(1-オクチルピペリジン-4-イル)エチル]-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-〔2-(1-ドデシルピペリジン-4-イル)エチル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲26記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

28. 一般式

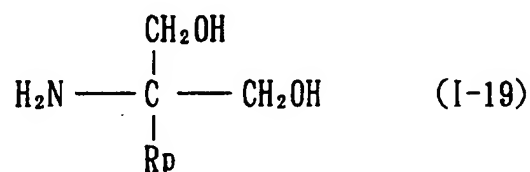


(式中、R₀ はアルキル部の炭素数が6～20個であるチエニルアルキル、アルキル部の炭素数の総計が6～20個であるアルキル置換チエニルアルキル、アルキル部の炭素数が6～20個であるピリジルアルキルまたはアルキル部の炭素数の総計が6～20個であるアルキル置換ピリジルアルキルを示す。) により表される請求の範囲12記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

29. 2-アミノ-2-〔2-(5-オクチル-2-チエニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(5-ノニル-2-チエニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(5-デシル-2-チエニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(5-ドデシル-2-チエニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔13-(2-チエニル)トリデシル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(5-オクチル-2-ピリジル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(5-デシル-2-ピリジル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔13-(2-ピリジル)トリ

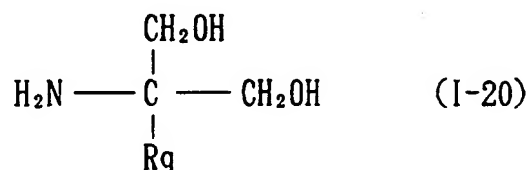
デシル〕－１，３－プロパンジオール、２－アミノ－２－〔２－（２－オクチル－５－ピリジル）エチル〕－１，３－プロパンジオール、２－アミノ－２－〔２－（２－デシル－５－ピリジル）エチル〕－１，３－プロパンジオールおよび２－アミノ－２－〔１，３－（３－ピリジル）トリデシル〕－１，３－プロパンジオールから選ばれる請求の範囲２８記載の２－アミノ－１，３－プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

３０． 一般式



〔式中、Rp は炭素数が６～１８個であるアルキルにより置換されたフェニル、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクルを示す。〕により表される請求の範囲１または２記載の２－アミノ－１，３－プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

３１． 一般式

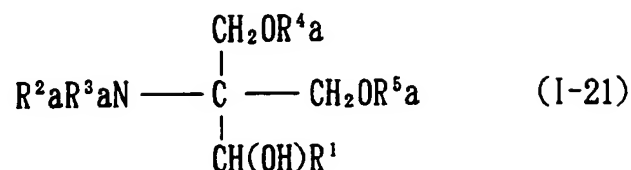


〔式中、Rq は炭素数が６～１８個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される請求の範囲３０記載の２－アミノ－１，３－プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

３２． ２－アミノ－２－（４－デシルフェニル）－１，３－プロパンジオール、２－アミノ－２－（４－ドデシルフェニル）－１，３－プロパンジオール、２－アミノ－２－（４－テトラデシルフェニル）－１，３－プロパンジオールおよび２－アミノ－２－（４－ヘキサデシルフェニル）－１，３－プロパンジオールから選ばれる請求の範囲３０または３１記載の２－アミノ－１，３－プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

ール化合物またはその製薬上許容される塩。

3 3. 一般式

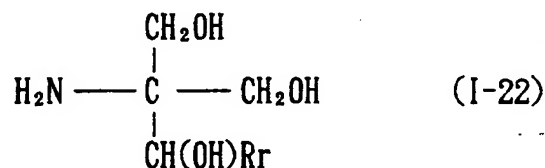


〔式中、 R^1 は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖（当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-\text{N}(\text{R}^6)-$ （ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す）、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端（ ω 位）に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体が置換していてもよい）または置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体を示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。〕により表される請求の範囲 1 または 2 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

3 4. 一般式

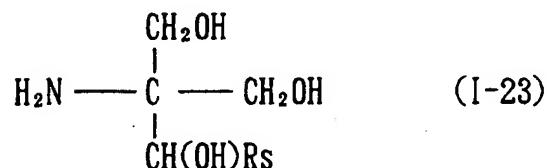


[式中、Rrは鎖中に二重結合またはカルボニルを有していてもよく、また水酸基および／またはヒドロキシイミノにより置換されていてもよいアルキルを示す。〕により表される請求の範囲 3 3 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

3 5. 2-アミノ-2-(1, 2, 12-トリヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(1, 2-ジヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(1, 12-ジヒドロキシ-4-オクタデセニル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(1, 2, 4-トリヒドロキシブチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(1, 2, 12-トリヒドロキシオクタデシル)-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-(1, 12-ジヒドロキシオクタ

デシル) - 1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲 3 3 または 3 4 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

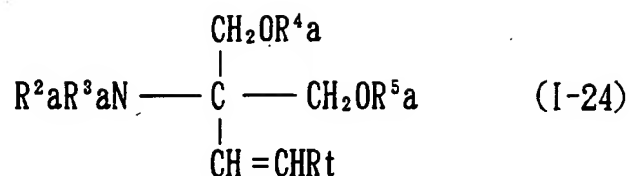
3 6. 一般式



(式中、Rs はハロゲンで置換されていてもよい炭素数 6 ~ 14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルキル、ハロゲンで置換されていてもよい炭素数 6 ~ 14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルコキシまたは炭素数 6 ~ 14 個の直鎖もしくは分枝鎖状のアルケニルオキシにより置換されたフェニルアルキルを示す。) により表される請求の範囲 3 3 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

3 7. 2-アミノ-2-〔1-ヒドロキシ-2-(4-オクチルフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ドデシルフェニル)-1-ヒドロキシエチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ヘプチルオキシフェニル)-1-ヒドロキシエチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔1-ヒドロキシ-2-(4-ウンデシルオキシフェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(8-フルオロオクチル)フェニル)-1-ヒドロキシエチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(12-フルオロドデシル)フェニル)-1-ヒドロキシエチル]-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-(7-フルオロヘプチルオキシ)フェニル)-1-ヒドロキシエチル]-1, 3-プロパンジオールおよび 2-アミノ-2-〔1-ヒドロキシ-2-(4-(11-フルオロウンデシルオキシ)フェニル)エチル]-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲 3 6 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

38. 一般式



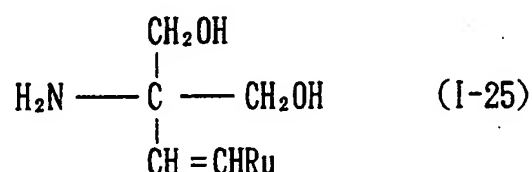
〔式中、Rt は置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖（当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-\text{N}(\text{R}^6)-$ （ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す）、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよい）または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体を示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレン、置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していても

よいヘテロアリアルもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。〕により表される請求の範囲 1 または 2 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

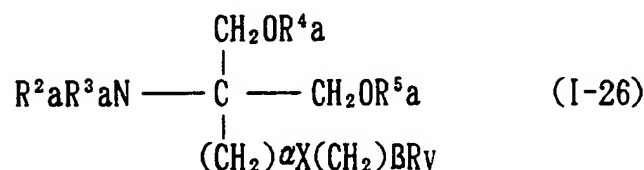
39. 一般式



〔式中、Ru は炭素数が 4～16 個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される請求の範囲 38 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

40. 2-アミノ-2-〔2-(4-オクチルフェニル)エテニル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-デシルフェニル)エテニル〕-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-〔2-(4-ドデシルフェニル)エテニル〕-1, 3-プロパンジオールおよび 2-アミノ-2-〔2-(4-テトラデシルフェニル)エテニル〕-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲 38 または 39 記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

41. 一般式

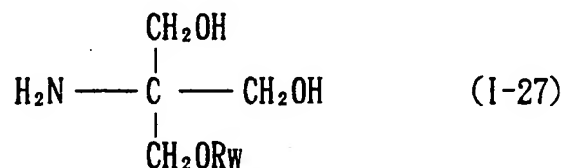


〔式中、Rv は置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよい

シクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体を示し、 R^2a 、 R^3a 、 R^4a 、 R^5a は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示し、 X は酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、 $-N(R^6)-$ （ここで、 R^6 は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す）を示し、 α 、 β は0または1～20の整数（但し、 $\alpha + \beta$ は5～20である）を示す。

また、上記置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。）により表される請求の範囲1または2記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

4 2. 一般式



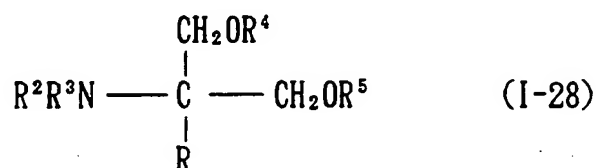
〔式中、 R_w は炭素数が4～16個であるアルキルにより置換されたフェニルを示す。〕により表される請求の範囲41記載の2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

4 3. 2-アミノ-2-(4-オクチルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(4-デシルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオール、2-アミノ-2-(4-ドデシルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオールおよび2-アミノ-2-(4-テトラデシルフェノキシメチル)-1, 3-プロパンジオールから選ばれる請求の範囲41または42記載の2-

アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩。

4.4. 請求の範囲1~4のいずれかに記載の化合物を含有してなる医薬組成物。

4.5. 一般式



〔式中、Rは置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖（当該鎖中に二重結合、三重結合、酸素、硫黄、スルフィニル、スルホニル、-N(R⁶)-（ここで、R⁶は水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示す）、カルボニル、置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体から選ばれる結合、複素原子または基を有していてもよく、また、当該鎖端に二重結合、三重結合、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体が置換していてもよい）または置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリールもしくはその脂環体を示し、R²、R³、R⁴、R⁵は同一または異なってそれぞれ水素、アルキル、アラルキル、アシルまたはアルコキシカルボニルを示すか、R⁴、R⁵がアルキル、アリールまたはアラルキルにより置換されていてもよいアルキレン鎖により結合していてもよい。

ここで、置換基を有していてもよい直鎖または分枝鎖状の炭素鎖は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアリールオキシ、置換基を有していてもよいシクロア

ルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体から選ばれる基を有していてもよい。

また、上記置換基を有していてもよいアリーレン、置換基を有していてもよいシクロアルキレンまたは置換基を有していてもよいヘテロアリーレンもしくはその脂環体は、置換基としてアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。さらに、置換基を有していてもよいアリアル、置換基を有していてもよいアリアルオキシ、置換基を有していてもよいシクロアルキルまたは置換基を有していてもよいヘテロアリアルもしくはその脂環体は、置換基としてアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アラルキルオキシ、アルキレンジオキシ、アシル、アルキルアミノ、アルキルチオ、アシルアミノ、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアミノ、アシルオキシ、アルキルカルバモイル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシから選ばれる基を有していてもよい。) により表される 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩を含有してなる免疫抑制剤。

46. 請求の範囲 1～43 のいずれかに記載の 2-アミノ-1, 3-プロパンジオール化合物またはその製薬上許容される塩を含有してなる免疫抑制剤。

47. 免疫抑制剤が拒絶反応抑制剤である請求の範囲 45 または 46 記載の薬剤。

48. 免疫抑制剤が自己免疫疾患の予防または治療薬である請求の範囲 45 または 46 記載の薬剤。

49. 自己免疫疾患の予防または治療薬がリウマチの予防または治療薬である請求の範囲 48 記載の薬剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP93/01515

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl⁵ C07C215/10, C07C233/18, C07C215/24, C07C215/28,
C07C323/25, C07C225/06, C07C229/22, C07C219/04,
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl⁵ C07C215/02-215/40, C07C217/28-217/40, C07C219/04-219/16
C07C225/02-225/18, C07C229/22, C07C233/18, C07C323/25,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAS ONLINE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	"Merck Index" 11th Edition (1989) Merck & Co., Inc., p. 1536-1537 [9684. Tromethamine]	1
X	JP, A, 63-2904 (SS Pharmaceutical Co., Ltd.), January 7, 1988 (07. 01. 88), Page 5, (Family: none)	1
X	JP, A, 57-156459 (Mitsui Toatsu Chemicals, Inc.), September 27, 1982 (27. 09. 82), Page 5, (Family: none)	1
X	JP, A, 58-101108 (Unitika, Ltd.), June 16, 1983 (16. 06. 83), (Family: none)	1
X	JP, A, 4-173723 (Kao Corp.), June 22, 1992 (22. 06. 92), (Family: none)	1
X	JP, A, 63-43140 (Fuji Photo Film Co., Ltd.), February 24, 1988 (24. 02. 88), Page 3, (Family: none)	1

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

January 10, 1994 (10. 01. 94)

Date of mailing of the international search report

February 1, 1994 (01. 02. 94)

Name and mailing address of the ISA/

Japanese Patent Office

Facsimile No.

Authorized officer

Telephone No.

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP, A, 4-69320 (Kao Corp.), March 4, 1992 (04. 03. 92), (Family: none)	1
X	JP, A, 51-54565 (Toa Eiyo K.K.), May 13, 1976 (13. 05. 76), Page 3, (Family: none)	1
X	JP, A, 4-9309 (Kao Corp.), January 14, 1992 (14. 01. 92) & EP, A2, 450527	1
X	JP, A, 57-21366 (Mitsui Toatsu Chemicals, Inc.), February 4, 1982 (04. 02. 82), Page 5 & EP, A2, 44203	1
X	US, A, 3660488 (Phillips Petroleum Company), May 2, 1972 (02. 05. 72), (Family: none)	1
X	US, A, 3432603 (Sterling Drug Inc.), March 11, 1969 (11. 03. 69), (Family: none)	1
X	US, A, 3426042 (Union Carbide Corporation), February 4, 1969 (04. 02. 69), (Family: none)	1
X	US, A, 3324043 (Sterling Drug Inc.), June 6, 1967 (06. 06. 67), (Family: none)	1
P	JP, A, 5-78294 (Kao Corp), March 30, 1993 (30. 03. 93), (Family: none)	1
X	JP, A, 4-224548 (Kao Corp.), August 13, 1992 (13. 08. 92), (Family: none)	1

A(Continuation). CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07C217/28, A61K31/13, A61K31/195, A61K31/215, A61K31/24

B(Continuation). FIELDS SEARCHED

A61K31/13, A61K31/195, A61K31/215, A61K31/24

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁵ C07C215/10, C07C233/18; C07C215/24,
C07C215/28, C07C323/25, C07C225/06,
C07C229/22, C07C219/04, C07C217/28.

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁵ C07C215/02-215/40, C07C217/28-217/40,
C07C219/04-219/16, C07C225/02-225/18,
C07C229/22, C07C233/18, C07C323/25.

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAS ONLINE

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	"Merck Index" 11th Edition (1989) Merck & Co., Inc., p. 1536-1537 [9684. Trometha- mine]	1
X	JP, A, 63-2904 (エスエス製薬株式会社), 7. 1月. 1988 (07. 01. 88), 第5 ページ (ファミリーなし)	1
X	JP, A, 57-156459 (三井東圧化学株式会社),	1

☒ C欄の続きにも文献が列举されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日
若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献
(理由を付す)
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日
の後に公表された文献

- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と
矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のため
に引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規
性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文
献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性
がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

10. 01. 94

国際調査報告の発送日

01.02.94

名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

脇村 善一 ㊞

4 H 7 4 5 7

電話番号 03-3581-1101 内線

3444

C (続き). 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
	27. 9月. 1982 (27. 09. 82), 第5 ページ (ファミリーなし)	
X	JP, A, 58-101108 (ユニチカ株式会社), 16. 6月. 1983 (16. 06. 83) (ファミリーなし)	1
X	JP, A, 4-173723 (花王株式会社), 22. 6月. 1992 (22. 06. 92) (ファミリーなし)	1
X	JP, A, 63-43140 (富士写真フイルム株式会社), 24. 2月. 1988 (24. 02. 88), 第3 ページ (ファミリーなし)	1
X	JP, A, 4-69320 (花王株式会社), 4. 3月. 1992 (04. 03. 92) (ファミリーなし)	1
X	JP, A, 51-54565 (東亜栄養株式会社), 13. 5月. 1976 (13. 05. 76), 第3 ページ (ファミリーなし)	1
X	JP, A, 4-9309 (花王株式会社), 14. 1月. 1992 (14. 01. 92) & EP, A2, 450527	1
X	JP, A, 57-21366 (三井東圧株式会社), 4. 2月. 1982 (04. 02. 82), 第5 ページ & EP, A2, 44203	1
X	US, A, 3660488 (Phillips Petroleum Company), 2. 5月. 1972 (02. 05. 72) (ファミリーなし)	1
X	US, A, 3432603 (Sterling Drug Inc.), 11. 3月. 1969 (11. 03. 69) (ファミリーなし)	1
X	US, A, 3426042 (Union Carbide Corporation), 4. 2月. 1969 (04. 02. 69) (ファミリーなし)	1
X	US, A, 3324043 (Sterling Drug Inc.), 6. 6月. 1967 (06. 06. 67) (ファミリーなし)	1
P	JP, A, 5-78294 (花王株式会社), 30. 3月. 1993 (30. 03. 93) (ファミリーなし)	1
X	JP, A, 4-224548 (花王株式会社), 13. 8月. 1992 (13. 08. 92) (ファミリーなし)	1

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

A61K31/13, A61K31/195, A61K31/215,
A61K31/24

B. 調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

A61K31/13, A61K31/195, A61K31/215,
A61K31/24